

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2018年10月18日(18.10.2018)



(10) 国際公開番号

WO 2018/190352 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 213/64 (2006.01) C07D 401/04 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01) C07D 405/04 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01) C07D 409/04 (2006.01)
A01N 43/653 (2006.01) C07D 413/04 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2018/015142

(22) 国際出願日: 2018年4月10日(10.04.2018)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:

特願 2017-078492 2017年4月11日(11.04.2017) JP
特願 2017-199795 2017年10月13日(13.10.2017) JP

(71) 出願人: 三井化学アグロ株式会社 (MITSUI
CHEMICALS AGRO, INC.) [JP/JP]; 〒1030027
東京都中央区日本橋一丁目19番
1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 梅谷 豪毅 (UMETANI Hideki);
〒2970017 千葉県茂原市東郷1144番地
三井化学アグロ株式会社内 Chiba (JP). 岡谷
駿(OKAYA Shun); 〒2970017 千葉県茂原市東
郷1144番地 三井化学アグロ株式会
社内 Chiba (JP). 生島 英明(IKISHIMA Hideaki);
〒2970017 千葉県茂原市東郷1144番地 三
井化学アグロ株式会社内 Chiba (JP). 福元 健
志(FUKUMOTO Takeshi); 〒2970017 千葉県茂
原市東郷1144番地 三井化学アグロ株式
会社内 Chiba (JP). 西田 章大(NISHIDA Akihiro);
〒2970017 千葉県茂原市東郷1144番地 三
井化学アグロ株式会社内 Chiba (JP). 柳 正
致(YANAGI Masanori); 〒2970017 千葉県茂
原市東郷1144番地 三井化学アグロ株式
会社内 Chiba (JP). 内藤 良平(NAITO Ryohei);
〒5202362 滋賀県野洲市市三宅1358 三井
化学アグロ株式会社内 Shiga (JP). 益富 光児
(MASUTOMI Koji); 〒2970017 千葉県茂原市東
郷1144番地 三井化学アグロ株式会社内
Chiba (JP). 白川 友美(SHIRAKAWA Tomomi);
〒2970017 千葉県茂原市東郷1144番地

三井化学アグロ株式会社内 Chiba (JP). 櫻田
茜(SAKURADA Akane); 〒2970017 千葉県茂原
市東郷1144番地 三井化学アグロ株式
会社内 Chiba (JP). 湯谷 智(YUTANI Satoshi);
〒5202362 滋賀県野洲市市三宅1358 三井
化学アグロ株式会社内 Shiga (JP).

(74) 代理人: 特許業務法人 津国, 外 (TSUKUNI
& ASSOCIATES et al.); 〒1020083 東京都千
代田区麹町5-3-1 麹町ビジネ
スセンター Tokyo (JP).

(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保
護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ,
BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT,
HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH,
KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY,
MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ,
NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT,
QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL,
SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA,
UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保
護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS,
MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ,
TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ,
DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT,
LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS,
SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM,
GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

一 国際調査報告 (条約第21条(3))

(54) Title: PYRIDONE COMPOUND, AND AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL FUNGICIDE HAVING THIS AS ACTIVE COMPONENT

(54) 発明の名称: ピリドン化合物およびそれを有効成分とする農園芸用殺菌剤

(57) Abstract: A novel compound is provided which controls plant disease. This pyridone compound is novel and can control plant disease.

(57) 要約: 植物病害を防除する新規な化合物を提供する。本発明のピリドン化合物は新規な化合物であり、植物病害を防除することができる。

WO 2018/190352 A1

明 細 書

発明の名称：

ピリドン化合物およびそれを有効成分とする農園芸用殺菌剤

技術分野

[0001] 本発明は、ピリドン化合物および該化合物を有効成分とする農薬に関するものである。

背景技術

[0002] 安定的な農業生産を確保する上で、農園芸作物の病害を防除することは重要な役割を果たす。そのため、様々な殺菌剤が使用されているが、長年にわたる殺菌剤の使用は薬剤耐性菌の出現を招くために、薬剤感受性菌のみならず薬剤耐性菌に対しても有効な新規殺菌剤が切望されている。

[0003] ところで、1, 3, 5, 6-置換-2-ピリドン化合物に関して、例えば、GABAアルファ-2/3リガンドとして、3位にアリール基またはヘテロアリール基を有する1, 3, 5, 6-置換-2-ピリドン化合物が開示されている（例えば、国際公開第98/55480号参照）。また、細菌性感染症の治療薬として、3位にカルボキシル基を有する1, 3, 5, 6-置換-2-ピリドン化合物が開示されている（例えば、欧州特許第0308020明細書参照）。

先行技術文献

特許文献

[0004] 特許文献1：国際公開第98/55480号
特許文献2：欧州特許第0308020明細書

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0005] しかしながら、国際公開第98/55480号および欧州特許第0308020明細書に記載されている化合物の用途は、いずれも医薬に関するものであり、本発明に係る農園芸用殺菌剤が属する技術分野とは相違する。

[0006] 本発明の課題は、農園芸用殺菌剤として有効である新規な化合物を提供することである。

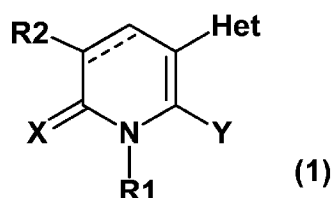
課題を解決するための手段

[0007] 本発明者らは、前記課題を解決すべく、1, 3, 5, 6-置換-2-ピリドン化合物群および1, 5, 6-置換-2-ピリドン化合物群について鋭意検討を行った結果、当該2-ピリドン骨格中の6位に関して、オルト位に置換基を有するアリール基またはヘテロアリール基を導入した新規な化合物群が、植物病害に対して優れた防除活性を発揮することを見出し、本発明を完成するに至った。

[0008] すなわち、本発明は、以下の通りである。

[0009] [1] 式(1)

[化1]



[式中、R 1 は、
 水酸基、
 シアノ基、
 置換基Aで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、
 C 1～C 6のハロアルキル基、
 置換基Aで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルキル基、
 置換基Aで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニル基、
 C 2～C 6のハロアルケニル基、
 置換基Aで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、
 C 2～C 6のハロアルキニル基、
 置換基Aで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、
 C 1～C 6のハロアルコキシ基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルコキシ基、
置換基Aで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニルオキシ基、
C 2～C 6のハロアルケニルオキシ基、
置換基Aで適宜置換されてもよいC 3～C 6のアルキニルオキシ基、
C 3～C 6のハロアルキニルオキシ基、
またはR^aR^bN-（ここで、R^aおよびR^bは、それぞれ独立していて、
水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1
～C 6のハロアルキル基、またはC 3～C 8のシクロアルキル基を表すか、
あるいはR^aおよびR^bは、結合する窒素原子と一緒にあって、アジリジニ
ル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニ
ル基、またはアゾカニル基を形成するものを表す。）を表し；

R²は、

水素原子、

ニトロ基、

ハロゲン原子、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、

C 1～C 6のハロアルキル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルキル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニル基、

C 2～C 6のハロアルケニル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、

C 2～C 6のハロアルキニル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、

C 1～C 6のハロアルコキシ基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルコキシ基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニルオキシ基、

C 2～C 6のハロアルケニルオキシ基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 3～C 6のアルキニルオキシ基、

C₃～C₆のハロアルキニルオキシ基、

R_c—L—（ここで、R_cは、C₁～C₆のアルキル基、またはC₁～C₆のハロアルキル基を表し、Lは、S、SO、またはSO₂を表す。）

またはR_{x1}C(=O)—（ここで、R_{x1}は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルキル基、C₁～C₆のハロアルキル基、C₃～C₈のシクロアルキル基、C₁～C₆のアルコキシ基、C₁～C₆のハロアルコキシ基、C₃～C₈のシクロアルコキシ基、またはR_aR_bN—（ここで、R_aおよびR_bは前記と同義である。）を表す。）を表し；

H_etは、

5～6員の複素環基、または8～10員の複素環基を表し、

該5～6員の複素環基、または該8～10員の複素環基は、R₃が適宜0～6置換し（ただし、2置換以上のR₃がある場合、R₃はそれぞれ独立した置換基を表す。）

R₃は、

水酸基、

シアノ基、

ニトロ基、

ハロゲン原子、

置換基Cで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルキル基、

C₁～C₆のハロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC₃～C₈のシクロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルケニル基、

C₂～C₆ハロアルケニル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルキニル基、

C₂～C₆のハロアルキニル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、

C₁～C₆のハロアルコキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC₃～C₈のシクロアルコキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルケニルオキシ基、
C₂～C₆のハロアルケニルオキシ基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC₃～C₆のアルキニルオキシ基、
C₃～C₆のハロアルキニルオキシ基、
置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基、
置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基、
置換基Dで適宜置換されてもよいアリールオキシ基、
置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリールオキシ基、
置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキルオキシ基、
R^aR^bN－（ここで、R^aおよびR^bは、前記と同義である。）、
R^c－L－（ここで、R^cおよびLは、前記と同義である。）、
R^{x1}C(=O)－（ここでR^{x1}は、前記と同義である。）、
R^{x1}C(=O)O－（ここでR^{x1}は、前記と同義である。）、
R^{x2}C(=O)N(R^{x3})－（ここで、R^{x2}は、水素原子、置換基B
で適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルキル基、C₁～C₆のハロアルキ
ル基、C₃～C₈のシクロアルキル基、C₁～C₆のアルコキシ基、C₁～
C₆のハロアルコキシ基、C₃～C₈のシクロアルコキシ基、またはR^aR^b
N－（ここで、R^aおよびR^bは、前記と同義である。）を表し、R^{x3}
は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルキル基、
C₁～C₆のハロアルキル基、またはC₃～C₈のシクロアルキル基を表す
。）、
R^{x4}R^{x5}C=N－O－（ここで、R^{x4}およびR^{x5}は、それぞれ独立
して、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルキ
ル基、C₁～C₆のハロアルキル基、C₃～C₈のシクロアルキル基、C₁
～C₆のアルコキシ基、C₁～C₆のハロアルコキシ基、C₃～C₈のシク
ロアルコキシ基、またはR^aR^bN－（ここで、R^aおよびR^bは、前記と
同義である。）を表す。）、
または1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基を表し；

Yは、

フェニル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、
トリアジニル基、テトラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、イソチア
ゾリル基、またはチアジアゾリル基を表し、

該フェニル基は、R 4 がオルト位に置換し、さらにR 5 が適宜0～4置換し
(ただし、2置換以上のR 5 がある場合、R 5 はそれぞれ独立した置換基を
表す。)、

該ピリジル基、該ピリダジニル基、該ピリミジニル基、該ピラジニル基、該
トリアジニル基、または該テトラジニル基は、R 4 がオルト位に置換し、さ
らにR 5 が適宜0～3置換し(ただし、2置換以上のR 5 がある場合、R 5
はそれぞれ独立した置換基を表す。)、

該チエニル基、該チアゾリル基、該イソチアゾリル基、または該チアジアゾ
リル基は、R 4 がオルト位に置換し、さらにR 5 が適宜0～2置換し(ただ
し、2置換のR 5 がある場合、R 5 はそれぞれ独立した置換基を表す。)、

R 4 は、

水酸基、

シアノ基、

ニトロ基、

ハロゲン原子、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、

C 1～C 6のハロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニル基、

C 2～C 6ハロアルケニル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、

C 2～C 6のハロアルキニル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、

C 1～C 6のハロアルコキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC3～C8のシクロアルコキシ基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC2～C6のアルケニルオキシ基、
C2～C6のハロアルケニルオキシ基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC3～C6のアルキニルオキシ基、
C3～C6のハロアルキニルオキシ基、
置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基、
置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基、
置換基Dで適宜置換されてもよいアリールオキシ基、
置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリールオキシ基、
置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキルオキシ基、
R^aR^bN－（ここで、R^aおよびR^bは、前記と同義である。）、
R^c－L－（ここで、R^cおよびLは、前記と同義である。）、
R^{x1}C(=O)－（ここでR^{x1}は、前記と同義である。）、
R^{x1}C(=O)O－（ここでR^{x1}は、前記と同義である。）、
R^{x2}C(=O)N(R^{x3})－（ここで、R^{x2}は、水素原子、置換基B
で適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキ
ル基、C3～C8のシクロアルキル基、C1～C6のアルコキシ基、C1～
C6のハロアルコキシ基、C3～C8のシクロアルコキシ基、またはR^aR^b
N－（ここで、R^aおよびR^bは、前記と同義である。）を表し、R^{x3}
は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、
C1～C6のハロアルキル基、またはC3～C8のシクロアルキル基を表す
。）、
R^{x4}R^{x5}C=N－O－（ここで、R^{x4}およびR^{x5}は、それぞれ独立
して、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキ
ル基、C1～C6のハロアルキル基、C3～C8のシクロアルキル基、C1
～C6のアルコキシ基、C1～C6のハロアルコキシ基、C3～C8のシク
ロアルコキシ基、またはR^aR^bN－（ここで、R^aおよびR^bは、前記と
同義である。）を表す。）、

または 1 ～ 2 個の酸素原子を含む 3 ～ 6 員環の基を表し、

R 5 は、前記に記載の R 4 と同義であり；

X は、酸素原子、または硫黄原子を表し；

破線部を含む結合は、二重結合、または単結合を表し；

そして、置換基 A は、水酸基、シアノ基、C 3 ～ C 8 のシクロアルキル基、C 1 ～ C 6 のアルコキシ基、C 1 ～ C 6 のハロアルコキシ基、C 3 ～ C 8 のシクロアルコキシ基、R a R b N —（ここで、R a および R b は、前記と同義である。）、および R c — L —（ここで、R c および L は、前記と同義である。）からなる群から選択される少なくとも 1 種であり；

置換基 B は、シアノ基、C 1 ～ C 6 のアルコキシ基、C 1 ～ C 6 のハロアルコキシ基、および C 3 ～ C 8 のシクロアルコキシ基からなる群から選択される少なくとも 1 種であり；

置換基 C は、水酸基、シアノ基、C 3 ～ C 8 のシクロアルキル基、C 1 ～ C 6 のアルコキシ基、C 1 ～ C 6 のハロアルコキシ基、C 3 ～ C 8 のシクロアルコキシ基、C 2 ～ C 6 のアルコキシアルコキシ基、R a R b N —（ここで、R a および R b は、前記と同義である。）、R c — L —（ここで R c および L は、前記と同義である。）、R x 1 C (=O) —（ここで R x 1 は、前記と同義である。）、および 1 ～ 2 個の酸素原子を含む 3 ～ 6 員環の基からなる群から選択される少なくとも 1 種であり；

置換基 D は、水酸基、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、置換基 B で置換されてもよい C 1 ～ C 6 のアルキル基、C 1 ～ C 6 のハロアルキル基、C 3 ～ C 8 のシクロアルキル基、C 1 ～ C 6 のアルコキシ基、C 1 ～ C 6 のハロアルコキシ基、および C 3 ～ C 8 のシクロアルコキシ基からなる群から選択される少なくとも 1 種である。］で表される化合物またはその塩。

[0010] [2] H e t は、

ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、テトラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、チアトリアゾリル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダ

ゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ペンタゾリル基、フリル基、オキサゾリル基、インドリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフリル基、イソベンゾフリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチエニル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾイソチアゾリル基、ベンゾチアジアゾリル基、インドリジニル基、イミダゾピリジニル基、ピラゾロピリジニル基、トリアゾロピリジニル基、ピロロピリミジニル基、イミダゾピリミジニル基、ピラゾロピリミジニル基、トリアゾロピリミジニル基、ピロロピラジニル基、イミダゾピラジニル基、ピラゾロピラジニル基、トリアゾロピラジニル基、キノリル基、イソキノリル基、シノリル基、フタラジニル基、キノキサリニル基、キナゾリニル基、ナフチリジニル基、または1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基を表し、該ピリジニル基、該ピリダジニル基、該ピリミジニル基、該ピラジニル基、該トリアジニル基、または該テトラジニル基は、R³が適宜0～4置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。））、

該チエニル基、該チアゾリル基、該イソチアゾリル基、該チアジアゾリル基、または該チアトリアゾリル基は、R³が適宜0～3置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。））、

該ピロリル基、該ピラゾリル基、該イミダゾリル基、該トリアゾリル基、該テトラゾリル基、または該ペンタゾリル基は、R³が適宜0～4置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。））、

該フリル基、または該オキサゾリル基は、R³が適宜0～3置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。））、

該インドリル基、該イソインドリル基、該インダゾリル基、該ベンゾイミダゾリル基、または該ベンゾトリアゾリル基は、R³が適宜0～6置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す）

。）、

該ベンゾフリル基、該イソベンゾフリル基、または該ベンゾオキサゾリル基は、R³が適宜0～5置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

該ベンゾチエニル基、該ベンゾチアゾリル基、該ベンゾイソチアゾリル基、または該ベンゾチアジアゾリル基は、R³が適宜0～5置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

該インドリジニル基、該イミダゾピリジル基、該ピラゾロピリジル基、または該トリアゾロピリジル基は、R³が適宜0～6置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

該ピロロピリミジニル基、該イミダゾピリミジニル基、該ピラゾロピリミジニル基、該トリアゾロピリミジニル基、該ピロロピラジニル基、該イミダゾピラジニル基、該ピラゾロピラジニル基、または該トリアゾロピラジニル基は、R³が適宜0～5置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

該キノリル基、該イソキノリル基、該シノリル基、該フタラジニル基、該キノキサリニル基、該キナゾリニル基、または該ナフチリジニル基は、R³が適宜0～6置換する（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

[1]に記載の化合物またはその塩。

[0011] [3] R¹は、

置換基Aで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基、

C¹～C⁶のハロアルキル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC²～C⁶のアルケニル基、

C²～C⁶のハロアルケニル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC²～C⁶のアルキニル基、

C²～C⁶のハロアルキニル基、

またはR^aR^bN-（ここで、R^aおよびR^bは、それぞれ独立していて、

水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、またはC3～C8のシクロアルキル基を表すか、あるいはR_aおよびR_bは、結合する窒素原子と一緒にあって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、またはアゾカニル基を形成するものを表す。)を表し；

R₂は、

水素原子、

ハロゲン原子、

置換基Aで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、

C1～C6のハロアルキル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC2～C6のアルキニル基、

C2～C6のハロアルキニル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC1～C6のアルコキシ基、

C1～C6のハロアルコキシ基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC2～C6のアルケニルオキシ基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC3～C6のアルキニルオキシ基、

R_c-L- (ここで、R_cは、C1～C6のアルキル基、またはC1～C6のハロアルキル基を表し、Lは、S、SO、またはSO₂を表す。)、

またはR_{x1}C(=O)- (ここで、R_{x1}は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、C3～C8のシクロアルキル基、C1～C6のアルコキシ基、C1～C6のハロアルコキシ基、C3～C8のシクロアルコキシ基、またはR_aR_bN- (ここで、R_aおよびR_bは前記と同義である。)を表す。)を表し；

H_{e t}は、

ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、テトラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、チアトリアゾリル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ペンタゾリル基、フリル基、

オキサゾリル基、または1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基を表し、
該ピリジル基、該ピリダジニル基、該ピリミジニル基、該ピラジニル基、該
トリアジニル基、または該テトラジニル基は、R³が適宜0～4置換し（た
だし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す
。）、

該チエニル基、該チアゾリル基、該イソチアゾリル基、該チアジアゾリル基
、または該チアトリアゾリル基は、R³が適宜0～3置換し（ただし、2置
換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

該ピロリル基、該ピラゾリル基、該イミダゾリル基、該トリアゾリル基、該
テトラゾリル基、または該ペンタゾリル基は、R³が適宜0～4置換し（た
だし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す
。）、

該フリル基、または該オキサゾリル基は、R³が適宜0～3置換し（ただし
、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）

、

R³は、

シアノ基、

ニトロ基、

ハロゲン原子、

置換基Cで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基、

C¹～C⁶のハロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC³～C⁸のシクロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC²～C⁶のアルケニル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC²～C⁶のアルキニル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルコキシ基、

C¹～C⁶のハロアルコキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC³～C⁸のシクロアルコキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC²～C⁶のアルケニルオキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC3～C6のアルキニルオキシ基、
R^aR^bN-（ここで、R^aおよびR^bは、それぞれ独立していて、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、またはC3～C8のシクロアルキル基を表すか、あるいはR^aおよびR^bは、結合する窒素原子と一緒にあって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、またはアゾカニル基を形成するものを表す。））、

R^c-L-（ここで、R^cおよびLは、前記と同義である。））、

R^x1C(=O)-（ここでR^x1は、前記と同義である。））、

R^x1C(=O)O-（ここでR^x1は、前記と同義である。））、

R^x2C(=O)N(R^x3)-（ここで、R^x2は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、C3～C8のシクロアルキル基、C1～C6のアルコキシ基、C1～C6のハロアルコキシ基、C3～C8のシクロアルコキシ基、またはR^aR^bN-（ここで、R^aおよびR^bは、前記と同義である。））を表し、R^x3は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、またはC3～C8のシクロアルキル基を表す。）を表し；

Yは、

フェニル基、またはピリジル基を表し、

該フェニル基は、R⁴がオルト位に置換し、さらにR⁵が適宜0～4置換し（ただし、2置換以上のR⁵がある場合、R⁵はそれぞれ独立した置換基を表す。））、

該ピリジル基は、R⁴がオルト位に置換し、さらにR⁵が適宜0～3置換し（ただし、2置換以上のR⁵がある場合、R⁵はそれぞれ独立した置換基を表す。））、

R⁴は、

シアノ基、

ニトロ基、
ハロゲン原子、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、
C 1～C 6のハロアルキル基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、
またはC 1～C 6のハロアルコキシ基を表し、
R 5は、
水酸基、
シアノ基、
ハロゲン原子、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、
C 1～C 6のハロアルキル基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルキル基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニル基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、
C 1～C 6のハロアルコキシ基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルコキシ基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニルオキシ基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 6のアルキニルオキシ基、
R a R b N－（ここで、R aおよびR bは、前記と同義である。）、
R c－L－（ここで、R cおよびLは、前記と同義である。）、
またはR x 1 C（＝O）O－（ここでR x 1は、前記と同義である。）を表す、

[2] に記載の化合物またはその塩。

[0012] [4] R 1 は、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、
C 1～C 6のハロアルキル基、

または $R^a R^b N-$ （ここで、 R^a および R^b は、それぞれ独立していて、水素原子、置換基 B で適宜置換されてもよい C 1 ～ C 6 のアルキル基、C 1 ～ C 6 のハロアルキル基、または C 3 ～ C 8 のシクロアルキル基を表すか、あるいは R^a および R^b は、結合する窒素原子と一緒にあって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、またはアゾカニル基を形成するものを表す。）を表し；

R^2 は、

水素原子、

ハロゲン原子、

置換基 A で適宜置換されてもよい C 1 ～ C 6 のアルキル基、

C 1 ～ C 6 のハロアルキル基、

置換基 A で適宜置換されてもよい C 2 ～ C 6 のアルキニル基、

置換基 A で適宜置換されてもよい C 1 ～ C 6 のアルコキシ基、

または $R^{x1} C(=O)-$ （ここで、 R^{x1} は、水素原子、置換基 B で適宜置換されてもよい C 1 ～ C 6 のアルキル基、C 1 ～ C 6 のハロアルキル基、C 3 ～ C 8 のシクロアルキル基、C 1 ～ C 6 のアルコキシ基、C 1 ～ C 6 のハロアルコキシ基、C 3 ～ C 8 のシクロアルコキシ基、または $R^a R^b N-$ （ここで、 R^a および R^b は前記と同義である。）を表す。）を表し；

Het は、

ピリジル基、チエニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、オキサゾリル基、または 1 ～ 2 個の酸素原子を含む 3 ～ 6 員環の基を表し、

該ピリジル基は、 R^3 が適宜 0 ～ 4 置換し（ただし、2 置換以上の R^3 がある場合、 R^3 はそれぞれ独立した置換基を表す。）

該チエニル基は、 R^3 が適宜 0 ～ 3 置換し（ただし、2 置換以上の R^3 がある場合、 R^3 はそれぞれ独立した置換基を表す。）

該ピロリル基、該ピラゾリル基、該イミダゾリル基、該トリアゾリル基、または該テトラゾリル基は、 R^3 がそれぞれ独立して適宜 0 ～ 4 置換し（た

し、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。

)、

該オキサゾリル基は、R³が適宜0～2置換し（ただし、2置換のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。））、

R³は、

シアノ基、

ニトロ基、

ハロゲン原子、

置換基Cで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基、

C¹～C⁶のハロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルコキシ基、

R^aR^bN－（ここで、R^aおよびR^bは、それぞれ独立していて、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基、C¹～C⁶のハロアルキル基、またはC³～C⁸のシクロアルキル基を表すか、あるいはR^aおよびR^bは、結合する窒素原子と一緒にあって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、またはアゾカニル基を形成するものを表す。））、

R^{x1}C(=O)－（ここでR^{x1}は、前記と同義である。））、

R^{x2}C(=O)N(R^{x3})－（ここで、R^{x2}は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基、C¹～C⁶のハロアルキル基、C³～C⁸のシクロアルキル基、C¹～C⁶のアルコキシ基、C¹～C⁶のハロアルコキシ基、C³～C⁸のシクロアルコキシ基、またはR^aR^bN－（ここで、R^aおよびR^bは、前記と同義である。）を表し、R^{x3}は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基、C¹～C⁶のハロアルキル基、またはC³～C⁸のシクロアルキル基を表す。）

を表し；

Yは、

フェニル基を表し、

該フェニル基は、R⁴がオルト位に置換し、さらにR⁵が適宜0～4置換し（ただし、2置換以上のR⁵がある場合、R⁵はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

R⁴は、

シアノ基、

ニトロ基、

ハロゲン原子、

置換基Cで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基、

C¹～C⁶のハロアルキル基、

または置換基Cで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルコキシ基を表し、

R⁵は、

水酸基、

シアノ基、

ハロゲン原子、

置換基Cで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルコキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC²～C⁶のアルケニルオキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC³～C⁶のアルキニルオキシ基、

R^aR^bN－（ここで、R^aおよびR^bは、前記と同義である。）、

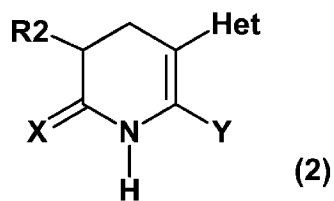
R^c－L－（ここで、R^cおよびLは、前記と同義である。）、

またはR^{x1}C(=O)O－（ここでR^{x1}は、前記と同義である。）を表す、

[3]に記載の化合物またはその塩。

[0013] [5] 式(2)

[化2]



[式中、R²は、
 水素原子、
 ニトロ基、
 ハロゲン原子、
 置換基Aで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基、
 C¹～C⁶のハロアルキル基、
 置換基Aで適宜置換されてもよいC³～C⁸のシクロアルキル基、
 置換基Aで適宜置換されてもよいC²～C⁶のアルケニル基、
 C²～C⁶のハロアルケニル基、
 置換基Aで適宜置換されてもよいC²～C⁶のアルキニル基、
 C²～C⁶のハロアルキニル基、
 置換基Aで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルコキシ基、
 C¹～C⁶のハロアルコキシ基、
 置換基Aで適宜置換されてもよいC³～C⁸のシクロアルコキシ基、
 置換基Aで適宜置換されてもよいC²～C⁶のアルケニルオキシ基、
 C²～C⁶のハロアルケニルオキシ基、
 置換基Aで適宜置換されてもよいC³～C⁶のアルキニルオキシ基、
 C³～C⁶のハロアルキニルオキシ基、
 R^c—L—（ここで、R^cは、C¹～C⁶のアルキル基、またはC¹～C⁶のハロアルキル基を表し、Lは、S、SO、またはSO₂を表す。）
 またはR^{x1}C(=O)—（ここで、R^{x1}は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基、C¹～C⁶のハロアルキル基、C³～C⁸のシクロアルキル基、C¹～C⁶のアルコキシ基、C¹～C⁶の

ハロアルコキシ基、C 3～C 8のシクロアルコキシ基、またはR a R b N⁻（ここで、R aおよびR bは、それぞれ独立していて、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、またはC 3～C 8のシクロアルキル基を表すか、あるいはR aおよびR bは、結合する窒素原子と一緒にあって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、またはアゾカニル基を形成するものを表す。）を表す。）を表し；

H e tは、

5～6員の複素環基、または8～10員の複素環基を表し、

該5～6員の複素環基、または該8～10員の複素環基は、R 3が適宜0～6置換し（ただし、2置換以上のR 3がある場合、R 3はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

R 3は、

水酸基、

シアノ基、

ニトロ基、

ハロゲン原子、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、

C 1～C 6のハロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニル基、

C 2～C 6ハロアルケニル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、

C 2～C 6のハロアルキニル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、

C 1～C 6のハロアルコキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルコキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニルオキシ基、

C 2 ~ C 6 のハロアルケニルオキシ基、
置換基 C で適宜置換されてもよい C 3 ~ C 6 のアルキニルオキシ基、
C 3 ~ C 6 のハロアルキニルオキシ基、
置換基 D で適宜置換されてもよいアリール基、
置換基 D で適宜置換されてもよいヘテロアリール基、
置換基 D で適宜置換されてもよいアリールオキシ基、
置換基 D で適宜置換されてもよいヘテロアリールオキシ基、
置換基 D で適宜置換されてもよいアラルキルオキシ基、
R a R b N - (ここで、R a および R b は、前記と同義である。)、
R c - L - (ここで、R c および L は、前記と同義である。)、
R x 1 C (=O) - (ここで R x 1 は、前記と同義である。)、
R x 1 C (=O) O - (ここで R x 1 は、前記と同義である。)、
R x 2 C (=O) N (R x 3) - (ここで、R x 2 は、水素原子、置換基 B
で適宜置換されてもよい C 1 ~ C 6 のアルキル基、C 1 ~ C 6 のハロアルキ
ル基、C 3 ~ C 8 のシクロアルキル基、C 1 ~ C 6 のアルコキシ基、C 1 ~
C 6 のハロアルコキシ基、C 3 ~ C 8 のシクロアルコキシ基、または R a R
b N - (ここで、R a および R b は、前記と同義である。)を表し、R x 3
は、水素原子、置換基 B で適宜置換されてもよい C 1 ~ C 6 のアルキル基、
C 1 ~ C 6 のハロアルキル基、または C 3 ~ C 8 のシクロアルキル基を表す
。)、
R x 4 R x 5 C = N - O - (ここで、R x 4 および R x 5 は、それぞれ独立
して、水素原子、置換基 B で適宜置換されてもよい C 1 ~ C 6 のアルキ
ル基、C 1 ~ C 6 のハロアルキル基、C 3 ~ C 8 のシクロアルキル基、C 1
~ C 6 のアルコキシ基、C 1 ~ C 6 のハロアルコキシ基、C 3 ~ C 8 のシク
ロアルコキシ基、または R a R b N - (ここで、R a および R b は、前記と
同義である。)を表す。)、
または 1 ~ 2 個の酸素原子を含む 3 ~ 6 員環の基を表し；
Y は、

フェニル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、
トリアジニル基、テトラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、イソチア
ゾリル基、またはチアジアゾリル基を表し、

該フェニル基は、R 4 がオルト位に置換し、さらにR 5 が適宜0～4置換し
(ただし、2置換以上のR 5がある場合、R 5はそれぞれ独立した置換基を
表す。)、

該ピリジル基、該ピリダジニル基、該ピリミジニル基、該ピラジニル基、該
トリアジニル基、または該テトラジニル基は、R 4 がオルト位に置換し、さ
らにR 5 が適宜0～3置換し(ただし、2置換以上のR 5がある場合、R 5
はそれぞれ独立した置換基を表す。)、

該チエニル基、該チアゾリル基、該イソチアゾリル基、または該チアジアゾ
リル基は、R 4 がオルト位に置換し、さらにR 5 が、適宜0～2置換し(た
だし、2置換のR 5がある場合、R 5はそれぞれ独立した置換基を表す。)

、

R 4 は、

水酸基、

シアノ基、

ニトロ基、

ハロゲン原子、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、

C 1～C 6のハロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニル基、

C 2～C 6ハロアルケニル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、

C 2～C 6のハロアルキニル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、

C 1～C 6のハロアルコキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC3～C8のシクロアルコキシ基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC2～C6のアルケニルオキシ基、
C2～C6のハロアルケニルオキシ基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC3～C6のアルキニルオキシ基、
C3～C6のハロアルキニルオキシ基、
置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基、
置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基、
置換基Dで適宜置換されてもよいアリールオキシ基、
置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリールオキシ基、
置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキルオキシ基、
R^aR^bN－（ここで、R^aおよびR^bは、前記と同義である。））、
R^c－L－（ここで、R^cおよびLは、前記と同義である。））、
R^{x1}C(=O)－（ここでR^{x1}は、前記と同義である。））、
R^{x1}C(=O)O－（ここでR^{x1}は、前記と同義である。））、
R^{x2}C(=O)N(R^{x3})－（ここで、R^{x2}は、水素原子、置換基B
で適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキ
ル基、C3～C8のシクロアルキル基、C1～C6のアルコキシ基、C1～
C6のハロアルコキシ基、C3～C8のシクロアルコキシ基、またはR^aR^b
N－（ここで、R^aおよびR^bは、前記と同義である。）を表し、R^{x3}
は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、
C1～C6のハロアルキル基、またはC3～C8のシクロアルキル基を表す
。））、
R^{x4}R^{x5}C=N－O－（ここで、R^{x4}およびR^{x5}は、それぞれ独立
して、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキ
ル基、C1～C6のハロアルキル基、C3～C8のシクロアルキル基、C1
～C6のアルコキシ基、C1～C6のハロアルコキシ基、C3～C8のシク
ロアルコキシ基、またはR^aR^bN－（ここで、R^aおよびR^bは、前記と
同義である。）を表す。））、

または1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基を表し、

R⁵は、前記に記載のR⁴と同義であり；

Xは、酸素原子、または硫黄原子を表し；

そして、置換基Aは、水酸基、シアノ基、C³～C⁸のシクロアルキル基、C¹～C⁶のアルコキシ基、C¹～C⁶のハロアルコキシ基、C³～C⁸のシクロアルコキシ基、R^aR^bN－（ここで、R^aおよびR^bは、前記と同義である。）、およびR^c－L－（ここで、R^cおよびLは、前記と同義である。）からなる群から選択される少なくとも1種であり；

置換基Bは、シアノ基、C¹～C⁶のアルコキシ基、C¹～C⁶のハロアルコキシ基、およびC³～C⁸のシクロアルコキシ基からなる群から選択される少なくとも1種であり；

置換基Cは、水酸基、シアノ基、C³～C⁸のシクロアルキル基、C¹～C⁶のアルコキシ基、C¹～C⁶のハロアルコキシ基、C³～C⁸のシクロアルコキシ基、C²～C⁶のアルコキシアルコキシ基、R^aR^bN－（ここで、R^aおよびR^bは、前記と同義である。）、R^c－L－（ここでR^cおよびLは、前記と同義である。）、R^x1C(=O)－（ここでR^x1は、前記と同義である。）、および1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基からなる群から選択される少なくとも1種であり；

置換基Dは、水酸基、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、置換基Bで置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基、C¹～C⁶のハロアルキル基、C³～C⁸のシクロアルキル基、C¹～C⁶のアルコキシ基、C¹～C⁶のハロアルコキシ基、およびC³～C⁸のシクロアルコキシ基からなる群から選択される少なくとも1種である。］で表される化合物またはその塩。

[0014] [6] R¹は、

C¹～C⁶のアルキル基、C¹～C⁶のハロアルキル基、またはR^aR^bN－（ここで、R^aおよびR^bは、それぞれ独立して、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基、C¹～C⁶のハロアルキル基、またはC³～C⁸のシクロアルキル基を表すか、あるいはR^aおよ

びR bは、結合する窒素原子と一緒にあって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、またはアゾカニル基を形成するものを表す。)を表す、[1]～[4]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0015] [7] R 1は、

メチル基、エチル基、プロピル基、2-フルオロエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、またはジエチルアミノ基を表す、[1]～[4]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0016] [8] R 1は、

メチル基、エチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、アミノ基、メチルアミノ基、またはジメチルアミノ基を表す、[1]～[4]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0017] [9] R 2は、

水素原子、ハロゲン原子、置換基Aで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、または置換基Aで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基を表す、[1]～[4]、[6]～[8]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0018] [10] R 2は、

水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メチル基、エチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、エチニル基、1-プロピニル基、プロパルギル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ホルミル基、アセチル基、メトキシアセチル基、シアノアセチル基、メトキシカルボニル基、またはエトキシカルボニル基を表す、[1]～[4]、[6]～[8]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

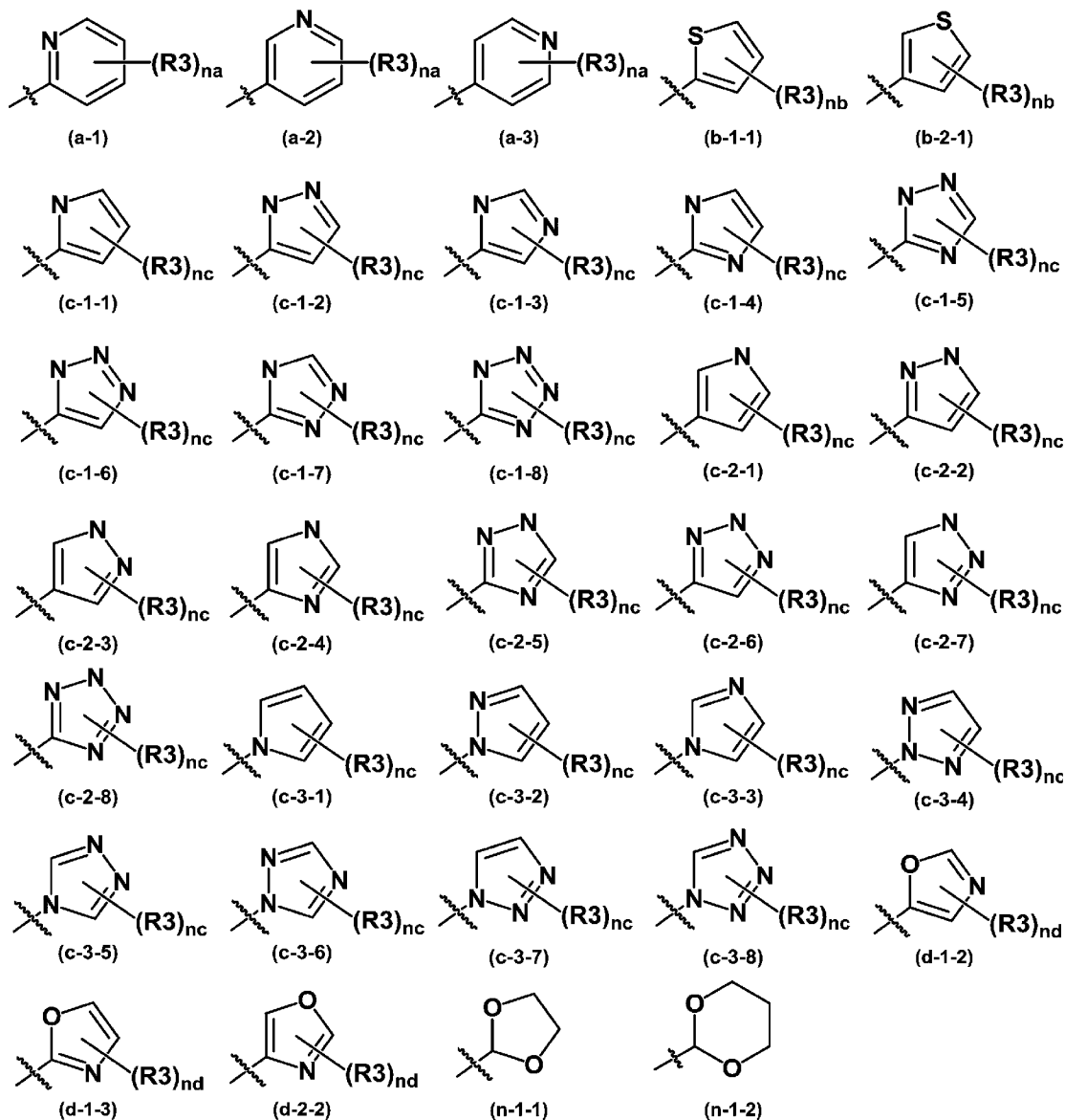
[0019] [11] R²は、

水素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、エチニル基、またはメトキシ基を表す、[1]～[4]、[6]～[8]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0020] [12] Hetは、

式(a-1)、式(a-2)、式(a-3)、式(b-1-1)、式(b-2-1)、式(c-1-1)、式(c-1-2)、式(c-1-3)、式(c-1-4)、式(c-1-5)、式(c-1-6)、式(c-1-7)、式(c-1-8)、式(c-2-1)、式(c-2-2)、式(c-2-3)、式(c-2-4)、式(c-2-5)、式(c-2-6)、式(c-2-7)、式(c-2-8)、式(c-3-1)、式(c-3-2)、式(c-3-3)、式(c-3-4)、式(c-3-5)、式(c-3-6)、式(c-3-7)、式(c-3-8)、式(d-1-2)、式(d-1-3)、式(d-2-2)、式(n-1-1)、または式(n-1-2)

[化3]



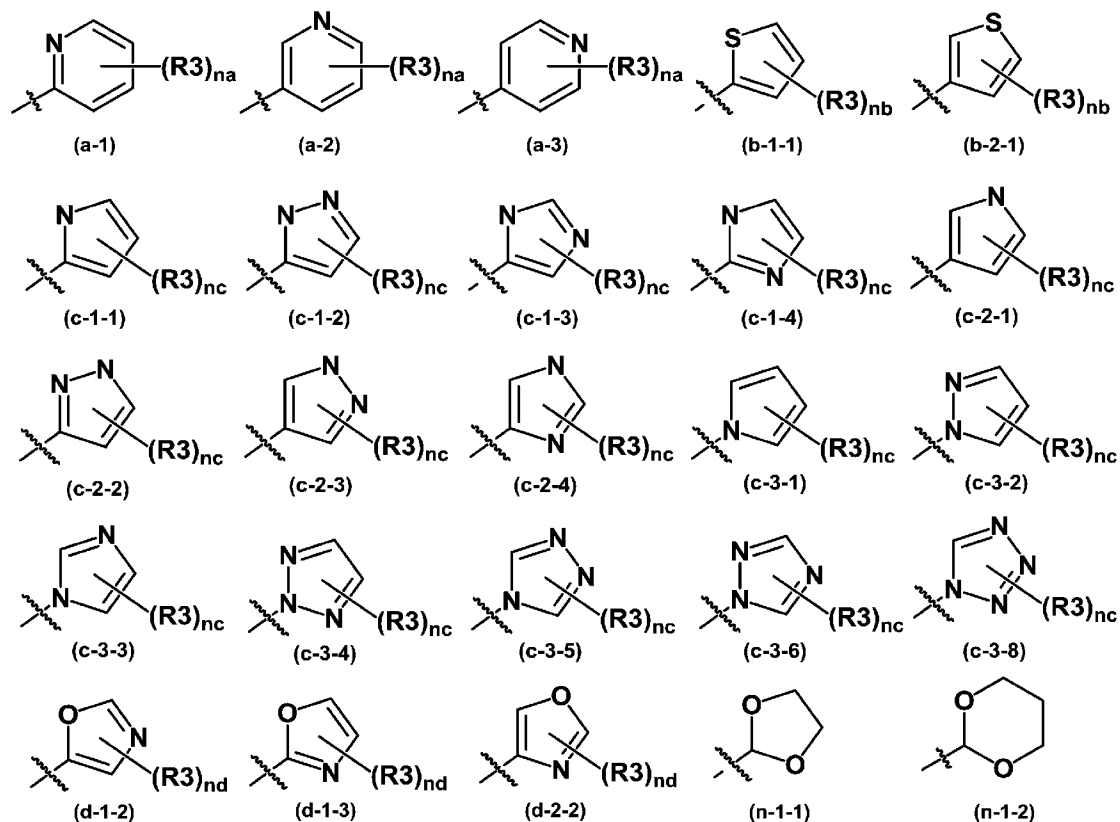
の部分構造（ここで、R₃は前記と同義であり、n_aは0～4の整数を表し、n_bは0～3の整数を表し、n_cは0～4の整数を表し、n_dは0～2の整数を表す。）を表す、[1]～[4]、[6]～[11]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0021] [13] H e t は、

式(a-1)、式(a-2)、式(a-3)、式(b-1-1)、式(b-2-1)、式(c-1-1)、式(c-1-2)、式(c-1-3)、式(c-1-4)、式(c-2-1)、式(c-2-2)、式(c-2-3)、

式(c-2-4)、式(c-3-1)、式(c-3-2)、式(c-3-3)、式(c-3-4)、式(c-3-5)、式(c-3-6)、式(c-3-8)、式(d-1-2)、式(d-1-3)、式(d-2-2)、式(n-1-1)、または式(n-1-2)

[化4]



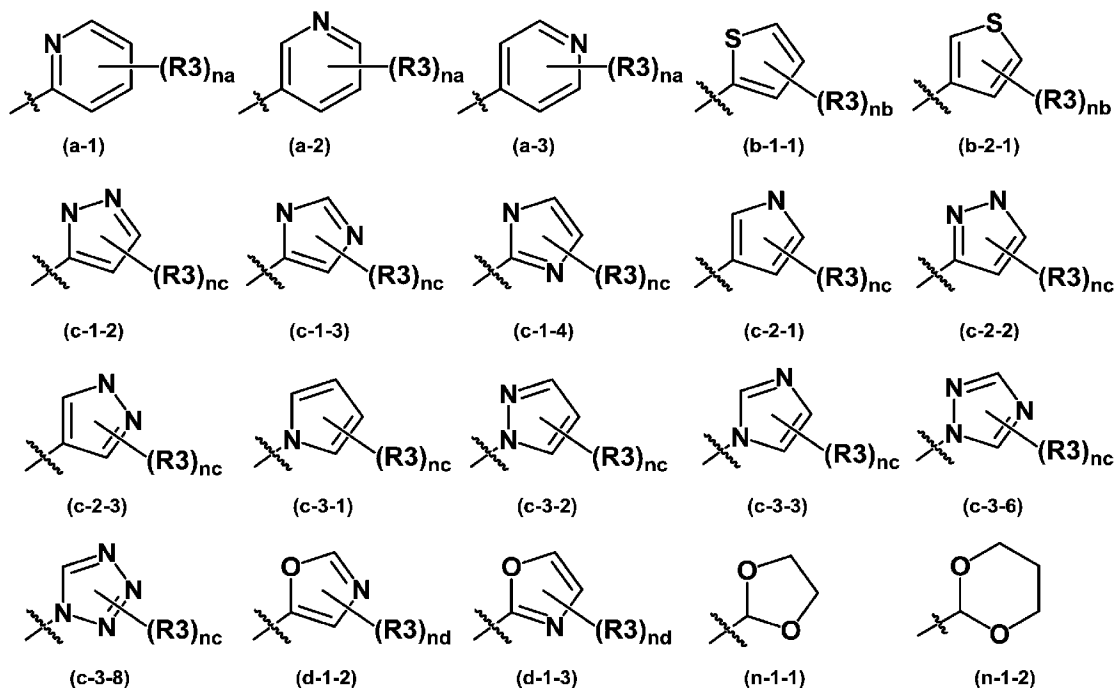
の部分構造（ここで、 $R3$ は前記と同義であり、 na は0～4の整数を表し、 nb は0～3の整数を表し、 nc は0～4の整数を表し、 nd は0～2の整数を表す。）を表す、[1]～[4]、[6]～[11]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0022] [14] Hetは、

式(a-1)、式(a-2)、式(a-3)、式(b-1-1)、式(b-2-1)、式(c-1-2)、式(c-1-3)、式(c-1-4)、式(c-2-1)、式(c-2-2)、式(c-2-3)、式(c-3-1)、式(c-3-2)、式(c-3-3)、式(c-3-6)、式(c-3-8)、式(d-1-2)、式(d-1-3)、式(n-1-1)、または式(

$n - 1 - 2$)

[化5]

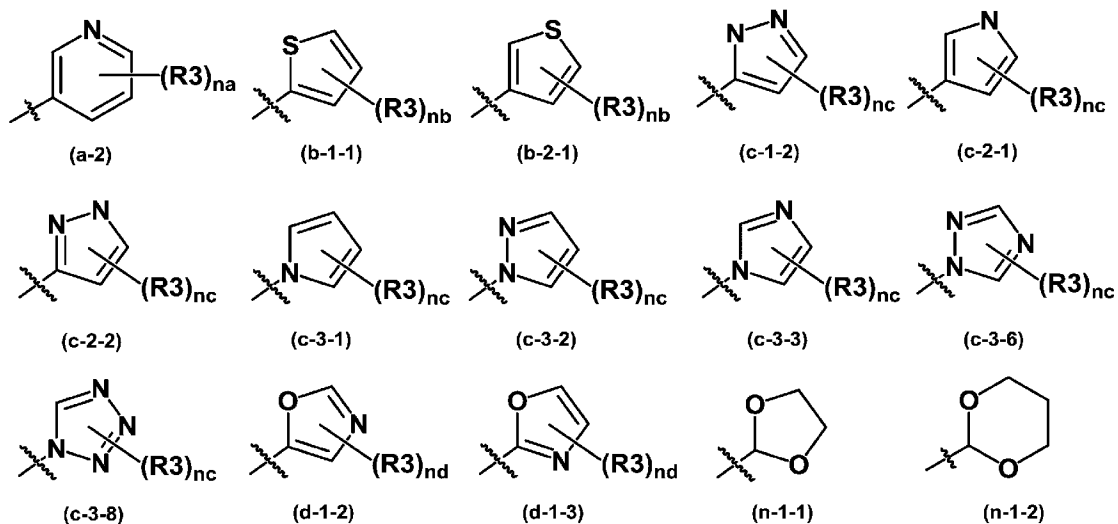


の部分構造（ここで、R 3は前記と同義であり、n aは0～4の整数を表し、n bは0～3の整数を表し、n cは0～4の整数を表し、n dは0～2の整数を表す。）を表す、[1]～[4]、[6]～[11]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0023] [15] Hetは、

式(a-2)、式(b-1-1)、式(b-2-1)、式(c-1-2)、式(c-2-1)、式(c-2-2)、式(c-3-1)、式(c-3-2)、式(c-3-3)、式(c-3-6)、式(c-3-8)、式(d-1-2)、式(d-1-3)、式(n-1-1)、または式(n-1-2)

[化6]

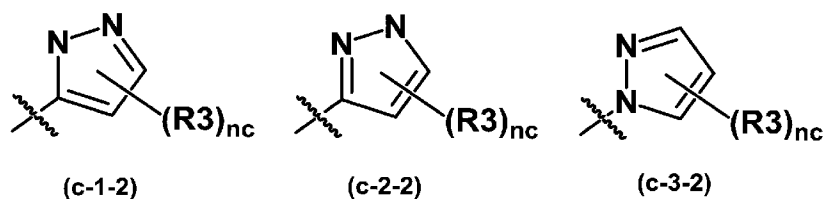


の部分構造（ここで、 $R3$ は前記と同義であり、 na は0～4の整数を表し、 nb は0～3の整数を表し、 nc は0～4の整数を表し、 nd は0～2の整数を表す。）を表す、[1]～[4]、[6]～[11]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0024] [16] Hetは、

式(c-1-2)、式(c-2-2)、または式(c-3-2)

[化7]

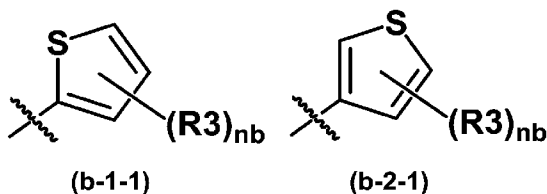


の部分構造（ここで、 $R3$ は前記と同義であり、 nc は0～3の整数を表す。）を表す、[1]～[4]、[6]～[11]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0025] [17] Hetは、

式(b-1-1)、または式(b-2-1)

[化8]



の部分構造（ここで、 R_3 は前記と同義であり、 nb は0～3の整数を表す。）を表す、[1]～[4]、[6]～[11]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0026] [18] R_3 は、

シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、置換基Cで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC1～C6のアルコキシ基、 $R_a R_b N-$ （ここで、 R_a および R_b は、それぞれ独立して、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、またはC3～C8のシクロアルキル基を表すか、あるいは R_a および R_b は、結合する窒素原子と一緒に、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、またはアゾカニル基を形成するもの）を表す。）を、または $R_{x1}C(=O)-$ （ここで、 R_{x1} は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、C3～C8のシクロアルキル基、C1～C6のアルコキシ基、C1～C6のハロアルコキシ基、C3～C8のシクロアルコキシ基、または $R_a R_b N-$ （ここで、 R_a および R_b は前記と同義である。）を表す。）を表す、[1]～[4]、[6]～[17]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0027] [19] R_3 は、

シアノ基、ニトロ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、モノブロモメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2,2-ジフルオロエチル基、2,2,2-トリフ

ルオロエチル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ホルミル基、アセチル基、メトキシアセチル基、シアノアセチル基、プロピオニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、またはアセチルアミド基を表す、[1]～[4]、[6]～[17]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0028] [20] R³は、

シアノ基、ニトロ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メチル基、モノブロモメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ホルミル基、またはエトキシカルボニル基を表す、[1]～[4]、[6]～[17]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0029] [21] Hetは、

オキサゾール-5-イル基、4-メトキシオキサゾール-5-イル基、4-メチルオキサゾール-5-イル基、4-ヨードオキサゾール-5-イル基、4-フルオロオキサゾール-5-イル基、4-クロロオキサゾール-5-イル基、4-ブロモオキサゾール-5-イル基、2-メトキシオキサゾール-5-イル基、2-メチルアミノオキサゾール-5-イル基、2-ジメチルアミノオキサゾール-5-イル基、2-ヨードオキサゾール-5-イル基、2-アミノオキサゾール-5-イル基、2-クロロオキサゾール-5-イル基、2,4-ジヨードオキサゾール-5-イル基、2,4-ジクロロオキサゾール-5-イル基、2,4-ジブロモオキサゾール-5-イル基、5-メトキシオキサゾール-2-イル基、チオフエン-2-イル基、5-クロロチオフエン-2-イル基、チオフエン-3-イル基、2-クロロチオフエン-3-イル基、2-ブロモチオフエン-3-イル基、2,5-ジクロロチオフエン-3-イル基、3-メチルチオフエン-2-イル基、3-クロロチオフエン-2-イル基、3-ブロモチオフエン-2-イル基、3,5-ジクロロチオフエン-2-イル基

、5-ブロモ-3-クロロ-チオフェン-2-イル基、5-ブロモ-3-メチル-チオフェン-2-イル基、3, 5-ジブロモ-チオフェン-2-イル基、3-ブロモ-5-クロロ-チオフェン-2-イル基、2-メチル-チオフェン-3-イル基、2, 5-ジブロモ-チオフェン-3-イル基、2-ブロモ-5-クロロ-チオフェン-3-イル基、5-ブロモ-2-クロロ-チオフェン-3-イル基、5-ブロモ-2-メチル-チオフェン-3-イル基、5-ブロモ-2-ブロモメチル-チオフェン-3-イル基、1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基、5-ヨード-1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基、5-ブロモ-1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基、3-クロロ-1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基、5-エトキシカルボニル-1H-イミダゾール-1-イル基、4, 5-ジクロロ-1H-イミダゾール-1-イル基、2, 4, 5-トリクロロ-1H-イミダゾール-1-イル基、3-シアノ-1H-ピロール-4-イル基、1H-ピロール-1-イル基、2, 5-ジメチル-1H-ピロール-1-イル基、2, 5-ジクロロ-1H-ピロール-1-イル基、1H-テトラゾール-1-イル基、2-クロロ-ピリジン-3-イル基、1, 3-ジオキサラン-2-イル基、1, 3-ジオキサソ-2-イル基、1H-ピラゾール-1-イル基、5-クロロ-4-メチル-1H-ピラゾール-1-イル基、5-ブロモ-4-メチル-1H-ピラゾール-1-イル基、4-ニトロ-1H-ピラゾール-1-イル基、4-メトキシ-1H-ピラゾール-1-イル基、4-メチル-1H-ピラゾール-1-イル基、4-ヨード-1H-ピラゾール-1-イル基、4-ホルミル-1H-ピラゾール-1-イル基、4-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-1-イル基、4-ジフルオロメチル-1H-ピラゾール-1-イル基、4-フルオロ-1H-ピラゾール-1-イル基、4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル基、4-ブロモ-1H-ピラゾール-1-イル基、4-アセチルアミノ-1H-ピラゾール-1-イル基、4-クロロ-3-メチル-1H-ピラゾール-1-イル基、4-クロロ-3, 5-ジメチル-1H-ピラゾール-1-イル基、4-ブロモ-3-メチル-

1 H-ピラゾール-1-イル基、4-ブロモ-3, 5-ジメチル-1 H-ピラゾール-1-イル基、3, 5-ジメチル-1 H-ピラゾール-1-イル基、3, 4-ジメチル-1 H-ピラゾール-1-イル基、4-ブロモ-1-メチル-1 H-ピラゾール-3-イル基、1, 4-ジメチル-1 H-ピラゾール-3-イル基、1-メチル-1 H-ピラゾール-5-イル基、4-クロロ-1-メチル-1 H-ピラゾール-5-イル基、または4-ブロモ-1-メチル-1 H-ピラゾール-5-イル基を表す、[1] ~ [4]、[6] ~ [15]、[18] ~ [20] のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0030] [22] Het は、

1 H-ピラゾール-1-イル基、5-クロロ-4-メチル-1 H-ピラゾール-1-イル基、5-ブロモ-4-メチル-1 H-ピラゾール-1-イル基、4-ニトロ-1 H-ピラゾール-1-イル基、4-メトキシ-1 H-ピラゾール-1-イル基、4-メチル-1 H-ピラゾール-1-イル基、4-ヨード-1 H-ピラゾール-1-イル基、4-ホルミル-1 H-ピラゾール-1-イル基、4-トリフルオロメチル-1 H-ピラゾール-1-イル基、4-ジフルオロメチル-1 H-ピラゾール-1-イル基、4-フルオロ-1 H-ピラゾール-1-イル基、4-クロロ-1 H-ピラゾール-1-イル基、4-ブロモ-1 H-ピラゾール-1-イル基、4-アセチルアミノ-1 H-ピラゾール-1-イル基、4-クロロ-3-メチル-1 H-ピラゾール-1-イル基、4-クロロ-3, 5-ジメチル-1 H-ピラゾール-1-イル基、4-ブロモ-3-メチル-1 H-ピラゾール-1-イル基、4-ブロモ-3, 5-ジメチル-1 H-ピラゾール-1-イル基、3, 5-ジメチル-1 H-ピラゾール-1-イル基、3, 4-ジメチル-1 H-ピラゾール-1-イル基、4-ブロモ-1-メチル-1 H-ピラゾール-3-イル基、1, 4-ジメチル-1 H-ピラゾール-3-イル基、1-メチル-1 H-ピラゾール-5-イル基、4-クロロ-1-メチル-1 H-ピラゾール-5-イル基、または4-ブロモ-1-メチル-1 H-ピラゾール-5-イル基を表す、[1] ~ [4]、[6] ~ [16]、[18] ~ [20] のいずれか1つに

記載の化合物またはその塩。

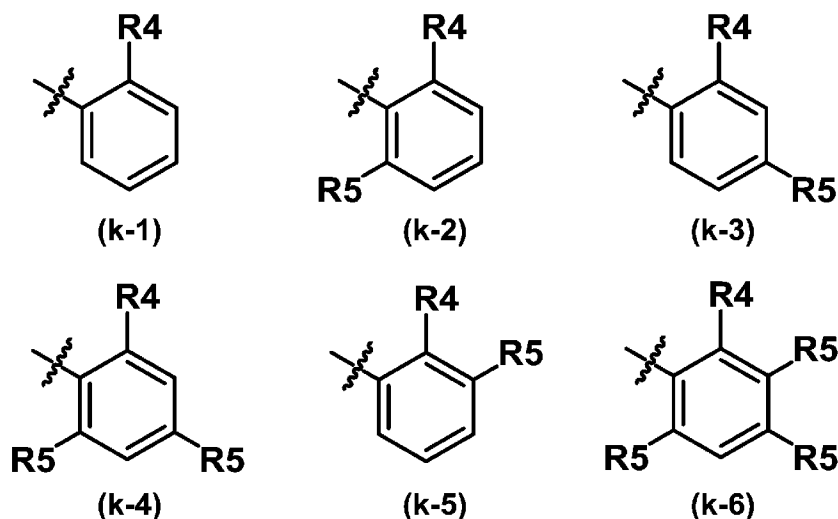
[0031] [23] Hetは、

チオフェン-2-イル基、5-クロロチオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基、2-クロロチオフェン-3-イル基、2-ブロモチオフェン-3-イル基、2,5-ジクロロチオフェン-3-イル基、3-メチルチオフェン-2-イル基、3-クロロチオフェン-2-イル基、3-ブロモチオフェン-2-イル基、3,5-ジクロロチオフェン-2-イル基、5-ブロモ3-クロロチオフェン-2-イル基、5-ブロモ3-メチルチオフェン-2-イル基、3,5-ジブロモチオフェン-2-イル基、3-ブロモ5-クロロチオフェン-2-イル基、2-メチルチオフェン-3-イル基、2,5-ジブロモチオフェン-3-イル基、2-ブロモ5-クロロチオフェン-3-イル基、5-ブロモ2-クロロチオフェン-3-イル基、5-ブロモ2-メチルチオフェン-3-イル基、または5-ブロモ2-ブロモメチルチオフェン-3-イル基を表す、[1]～[4]、[6]～[15]、[17]～[20]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0032] [24] Yは、

式(k-1)、式(k-2)、式(k-3)、式(k-4)、式(k-5)、または式(k-6)

[化9]

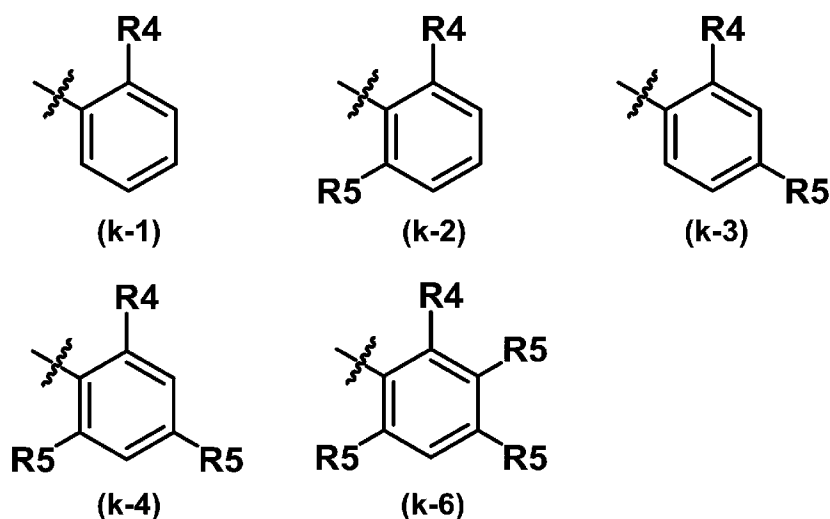


の部分構造を表す、[1]～[4]、[6]～[23]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0033] [25] Yは、

式(k-1)、式(k-2)、式(k-3)、式(k-4)、または式(k-6)

[化10]



の部分構造を表す、[1]～[4]、[6]～[23]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0034] [26] R4は、

シアノ基、ハロゲン原子、置換基Cで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、または置換基Cで適宜置換されてもよいC1～C6のアルコキシ基を表す、[1]～[4]、[6]～[25]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0035] [27] R4は、

シアノ基、ニトロ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基、またはエトキシ基を表す、[1]～[4]、[6]～[25]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0036] [28] R4は、

シアノ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、エチル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基を表す、[1]～[4]、[6]～[25]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0037] [29] R5は、

水酸基、シアノ基、ハロゲン原子、置換基Cで適宜置換されてもよいC1～C6のアルコキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC2～C6のアルケニルオキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC3～C6のアルキニルオキシ基、 $R^a R^b N-$ （ここで、 R^a および R^b は、それぞれ独立していて、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、またはC3～C8のシクロアルキル基を表すか、あるいは R^a および R^b は、結合する窒素原子と一緒にあって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、またはアゾカニル基を形成するものを表す。）、 R^c-L- （ここで、 R^c は、C1～C6のアルキル基、またはC1～C6のハロアルキル基を表し、 L は、S、SO、またはSO₂を表す。）、または $R \times 1 C(=O)O-$ （ここで、 $R \times 1$ は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、C3～C8のシクロアルキル基、C1～C6のアルコキシ基、C1～C6のハロアルコキシ基、C3～C8のシクロアルコキシ基、または $R^a R^b N-$ （ここで、 R^a および R^b は前記と同義である。）を表す。）を表す[1]～[4]、[6]～[28]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0038] [30] R5は、

水酸基、シアノ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メチル基、エチル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、シアノメトキシ基、メトキシメトキシ基、メトキシエトキシ基、ビニルオキシ基、1-プロペニルオキシ基、アリルオキシ基、プロパルギルオキシ基、2-ブチニルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ピロリジニル基、ピペ

リジニル基、メチルチオ基、メタンスルフィニル基、メタンスルホニル基、アセチルオキシ基、メトキシアセチルオキシ基、シアノアセチルオキシ基、ジフルオロアセチルオキシ基、トリフルオロアセチルオキシ基、メトキシカルボニルオキシ基、エトキシカルボニルオキシ基、アミノカルボニルオキシ基、ジメチルアミノカルボニルオキシ基、エチルメチルアミノカルボニルオキシ基、またはジエチルアミノカルボニルオキシ基を表す、[1]～[4]、[6]～[28]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0039] [31] R5は、

水酸基、シアノ基、フッ素原子、ヨウ素原子、メトキシ基、エトキシ基、メトキシメトキシ基、メトキシエトキシ基、アリルオキシ基、プロパルギルオキシ基、メチルアミノ基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、メチルチオ基、またはアセチルオキシ基を表す、[1]～[4]、[6]～[28]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0040] [32] Yは、

2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-フルオロフェニル基、2-クロロ-4-メトキシフェニル基、2, 6-ジフルオロ-4-(メチルアミノ)フェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、2-ブロモ-4-フルオロフェニル基、2-ブロモ-4-メトキシフェニル基、4-フルオロ-2-メチルフェニル基、2-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、2, 6-ジフルオロ-4-ヒドロキシフェニル基、2-クロロ-6-フルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロ-4-エトキシフェニル基、2, 6-ジフルオロ-4-(プロパルギルオキシ)フェニル基、2, 6-ジフルオロ-4-(アリルオキシ)フェニル基、2, 6-ジフルオロ-4-(メトキシメトキシ)フェニル基、2, 6-ジフルオロ-4-(2-メトキシエトキシ)フェニル基、2, 6-ジフルオロ-4-(アセチルオキシ)フェニル基、2-ブロモ-6-フルオロフェニル基、2-フルオロ

ーフェニル基、2-メチルフェニル基、2-メトキシフェニル基、2,6-ジフルオロ-3-ヨード-4-メトキシフェニル基、2-ニトロフェニル基、4-シアノ-2-フルオロフェニル基、2-エチルフェニル基、2-フルオロ-4-(メチルアミノ)フェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、2-フルオロ-4-(メチルチオ)フェニル基、2-フルオロ-4-(ピロリジン-1-イル)フェニル基、2-フルオロ-4-(ピペリジン-1-イル)フェニル基、2-シアノフェニル基、4-ブromo-2-フルオロフェニル基、または2-シアノ-4-フルオロフェニル基を表す、[1]～[4]、[6]～[23]のいずれか1つに記載の化合物またはその塩。

[0041] [33] Xが、
酸素原子である、[1]～[4]、[6]～[32]のいずれか1つに記載の化合物、またはその塩。

[0042] [34] Xが、
硫黄原子である、[1]～[4]、[6]～[32]のいずれか1つに記載の化合物、またはその塩。

[0043] [35] 破線部を含む結合が、
二重結合である、[1]～[4]、[6]～[34]のいずれか1つに記載の化合物、またはその塩。

[0044] [36] 破線部を含む結合が、
単結合である、[1]～[4]、[6]～[34]のいずれか1つに記載の化合物、またはその塩。

[0045] [37] [1]～[4]、[6]～[36]に記載の化合物またはその塩を有効成分として含有する農園芸用有害生物防除剤。

[0046] [38] [1]～[4]、[6]～[36]に記載の化合物またはその塩を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤。

[0047] [39] [37]に記載の農園芸用有害生物防除剤を、植物、植物の種子、または植物を栽培する土壌に施用することを含む、植物病害を防除する方

法。

[0048] [40] [38]に記載の農園芸用殺菌剤を、植物、植物の種子、または植物を栽培する土壌に施用することを含む、植物病害を防除する方法。

[0049] [41] 農園芸用有害生物防除剤としての[1]～[4]、[6]～[36]のいずれか1つに記載の化合物の使用。

[0050] [42] 農園芸用殺菌剤としての[1]～[4]、[6]～[36]のいずれか1つに記載の化合物の使用。

発明の効果

[0051] 本発明によれば、農園芸用殺菌剤として有効である新規な化合物を提供することができる。

発明を実施するための形態

[0052] 以下、本発明を実施するための形態について詳細に説明する。

[0053] なお、特許請求の範囲および明細書中において用いられる各用語は、特に断らない限り、当該技術分野において一般的に用いられる定義によるものとする。

[0054] 本明細書において、使用する略号を以下に説明する。

[0055] DMF：N，N-ジメチルホルムアミド、THF：テトラヒドロフラン、Me：メチル基、Et：エチル基、Pr：プロピル基、Bu：ブチル基、Ac：アセチル基、Ph：フェニル基、Py：ピリジル基、Thio：チエニル基、Pyrrolyl：ピロリル基、Pyr：ピラゾリル基、Imid：イミダゾリル基、Triazolyl：トリアゾリル基、Tetrazolyl：テトラゾリル基、Oxa：オキサゾリル基、i：イソ、sec：セカンダリ、t：ターシャリ、＝：二重結合、≡：三重結合を表す。表のカラム中、Pr、Buに関しては、接頭辞がない場合は、ノルマルを意味する。

[0056] 以下に、本明細書中に使用される用語の定義を説明する。

[0057] C_x～C_yとの記載は、x個からy個の炭素原子を有することを表す。ここで、x及びyは整数を表し、また、xとyとの間に存在する全ての整数も

個別に開示されているものと理解される。例えば、C 1～C 6は、1、2、3、4、5、または6個の炭素原子を、C 2～C 6は、2、3、4、5、または6個の炭素原子を、C 3～C 8は、3、4、5、6、7、または8個の炭素原子を、C 3～C 6は、3、4、5、または6個の炭素原子を、C 1～C 3は、1、2、または3個の炭素原子をそれぞれ有することを意味する。

[0058] 用語「適宜置換されてもよい」とは、置換または無置換であることを意味する。この用語を用いる際、置換基の数が明示されていないときは、置換基の数は1であることを表す。一方で、例えば、「適宜0～6置換されてもよい」と置換基の数が指定されている場合、0と6との間に存在する全ての整数も個別に開示されているものと理解される。即ち、置換基が、なし、1、2、3、4、5、または6個の置換基数であることを意味する。同様に、「適宜0～5置換されてもよい」では、置換基が、なし、1、2、3、4、または5個の置換基数を、「適宜0～4置換されてもよい」では、置換基が、なし、1、2、3、または4個の置換基数を、「適宜0～3置換されてもよい」では、なし、1、2、または3個の置換基数を、「適宜0～2置換されてもよい」では、なし、1、または2個の置換基数を、それぞれ有することを意味する。

[0059] C 1～C 6のアルキル基とは、直鎖状または分岐状でよく、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2-メチルブチル基、ネオペンチル基、1-エチルプロピル基、ヘキシル基、4-メチルペンチル基、3-メチルペンチル基、2-メチルペンチル基、1-メチルペンチル基、3,3-ジメチルブチル基、2,2-ジメチルブチル基、1,1-ジメチルブチル基、1,2-ジメチルブチル基、1,3-ジメチルブチル基、2,3-ジメチルブチル基、2-エチルブチル基、1-イソプロピルプロピル基、1,1,2-トリメチルプロピル基、1,2,2-トリメチルプロピル基等が挙げられる。

[0060] ハロゲン原子とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等が挙

げられる。

[0061] C 1 ～ C 6 のハロアルキル基とは、前記の C 1 ～ C 6 のアルキル基における水素原子が 1 個または 2 個以上のハロゲン原子によって任意に置換されたものを表す。2 個以上のハロゲン原子で置換される場合、それらのハロゲン原子は同一または異なっていてよく、その置換数は置換基として存在することができる限り特に制限はない。C 1 ～ C 6 のハロアルキル基の具体例として、モノフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、モノクロロメチル基、モノブロモメチル基、モノヨードメチル基、クロロジフルオロメチル基、ブロモジフルオロメチル基、1-フルオロエチル基、2-フルオロエチル基、1, 1-ジフルオロエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、2, 2, 2-トリクロロエチル基、3, 3, 3-ジフルオロプロピル基、3, 3, 3-トリフルオロプロピル基、ヘプタフルオロプロピル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、ノナフルオロブチル基、ノナフルオロ-sec-ブチル基、3, 3, 4, 4, 5, 5, 5-ヘプタフルオロペンチル基、ウンデカフルオロペンチル基、トリデカフルオロヘキシル基等が挙げられる。

[0062] C 3 ～ C 8 のシクロアルキル基とは、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基等が挙げられる。

[0063] C 2 ～ C 6 のアルケニル基とは、1 個または 2 個以上の二重結合を有し、直鎖状または分岐状である不飽和炭化水素基のものを表す。また、幾何異性体がある場合、E 体または Z 体のどちらか一方のみ、あるいは E 体と Z 体との任意の割合の混合物であり、指定される炭素数の範囲であれば、特に限定されることはない。C 2 ～ C 6 のアルケニル基の具体例として、ビニル基、1-プロペニル基、アリル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、4-ペ

ンテニル基、3-メチル-2-ブテニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、5-ヘキセニル基、4-メチル-3-ペンテニル基、3-メチル-2-ペンテニル基等が挙げられる。

[0064] C₂～C₆のハロアルケニル基とは、前記のC₂～C₆のアルケニル基における水素原子が1個または2個以上のハロゲン原子によって任意に置換されたものを表す。2個以上のハロゲン原子で置換される場合、それらのハロゲン原子は同一または異なっていてよく、その置換数は置換基として存在することができる限り特に制限はない。C₂～C₆のハロアルケニル基の具体例として、2-フルオロビニル基、2,2-ジフルオロビニル基、2,2-ジクロロビニル基、3-フルオロアリル基、3,3-ジフルオロアリル基、3,3-ジクロロアリル基、4,4-ジフルオロ-3-ブテニル基、5,5-ジフルオロ-4-ペンテニル基、6,6-ジフルオロ-5-ヘキセニル基等が挙げられる。

[0065] C₂～C₆のアルキニル基とは、1個または2個以上の三重結合を有し、直鎖状または分岐状である不飽和炭化水素基のものを表す。C₂～C₆のアルキニル基の具体例として、エチニル基、1-プロピニル基、プロパルギル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-ペンチニル基、2-ペンチニル基、3-ペンチニル基、4-ペンチニル基、1,1-ジメチル-2-プロピニル基、1-ヘキシニル基、2-ヘキシニル基、3-ヘキシニル基、4-ヘキシニル基、5-ヘキシニル基等が挙げられる。

[0066] C₂～C₆のハロアルキニル基とは、前記のC₂～C₆のアルキニル基における水素原子が1個または2個以上のハロゲン原子によって任意に置換されたものを表す。2個以上のハロゲン原子で置換される場合、それらのハロゲン原子は同一または異なっていてよく、その置換数は置換基として存在することができる限り特に制限はない。C₂～C₆のハロアルキニル基の具体例として、2-フルオロエチニル基、2-クロロエチニル基、2-ブロモエチニル基、2-ヨードエチニル基、3,3-ジフルオロ-1-プロピニル基、3-クロロ-3,3-ジフルオロ-1-プロピニル基、3-ブロモ-3,

3-ジフルオロ-1-プロピニル基、3, 3, 3-トリフルオロ-1-プロピニル基、4, 4-ジフルオロ-1-ブチニル基、4, 4-ジフルオロ-2-ブチニル基、4-クロロ-4, 4-ジフルオロ-1-ブチニル基、4-クロロ-4, 4-ジフルオロ-2-ブチニル基、4-ブロモ-4, 4-ジフルオロ-1-ブチニル基、4-ブロモ-4, 4-ジフルオロ-2-ブチニル基、4, 4, 4-トリフルオロ-1-ブチニル基、4, 4, 4-トリフルオロ-2-ブチニル基、5, 5-ジフルオロ-3-ペンチニル基、5-クロロ-5, 5-ジフルオロ-3-ペンチニル基、5-ブロモ-5, 5-ジフルオロ-3-ペンチニル基、5, 5, 5-トリフルオロ-3-ペンチニル基、6, 6-ジフルオロ-4-ヘキシニル基、6-クロロ-6, 6-ジフルオロ-4-ヘキシニル基、6-ブロモ-6, 6-ジフルオロ-4-ヘキシニル基、6, 6, 6-トリフルオロ-4-ヘキシニル基等が挙げられる。

[0067] C 1 ~ C 6 のアルコキシ基とは、前記の C 1 ~ C 6 のアルキル基が酸素原子を介して結合したものを表す。C 1 ~ C 6 のアルコキシ基として、具体的には、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、*sec*-ブトキシ基、*t*-ブトキシ基、ペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、1-メチルブトキシ基、2-メチルブトキシ基、ネオペンチルオキシ基、1-エチルプロピルオキシ基、1, 2-ジメチルプロピルオキシ基、ヘキシルオキシ基、1-メチルペンチルオキシ基、2-メチルペンチルオキシ基、3-メチルペンチルオキシ基、4-メチルペンチルオキシ基、1, 1-ジメチルブトキシ基、2, 2-ジメチルブトキシ基、3, 3-ジメチルブトキシ基、1, 2-ジメチルブトキシ基、1, 3-ジメチルブトキシ基、2, 3-ジメチルブトキシ基、2-エチルブトキシ基、1-イソプロピルプロピルオキシ基、1, 1, 2-トリメチルプロピルオキシ基、1, 2, 2-トリメチルプロピルオキシ基等が挙げられる。

[0068] C 1 ~ C 6 のハロアルコキシ基とは、前記の C 1 ~ C 6 のアルコキシ基における水素原子が1個または2個以上のハロゲン原子によって任意に置換さ

れたものを表す。2個以上のハロゲン原子で置換される場合、それらのハロゲン原子は同一または異なっていてよく、その置換数は置換基として存在することができる限り特に制限はない。C 1～C 6のハロアルコキシ基の具体例として、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、クロロジフルオロメトキシ基、ブロモジフルオロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリクロロエトキシ基、3, 3-ジフルオロプロピルオキシ基、3, 3, 3-トリフルオロプロピルオキシ基、ヘプタフルオロプロピルオキシ基、ヘプタフルオロイソプロピルオキシ基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)-エトキシ基、ノナフルオロブトキシ基、ノナフルオロ-sec-ブトキシ基、3, 3, 4, 4, 5, 5, 5-ヘプタフルオロペンチルオキシ基、ウンデカフルオロペンチルオキシ基、トリデカフルオロヘキシルオキシ基等が挙げられる。

[0069] C 3～C 8のシクロアルコキシ基とは、前記のC 3～C 8のシクロアルキル基が酸素原子を介して結合したものを表す。C 3～C 8のシクロアルコキシ基の具体例として、シクロプロピルオキシ基、シクロブトキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロヘプチルオキシ基、シクロオクチルオキシ基等が挙げられる。

[0070] C 2～C 6のアルケニルオキシ基とは、前記のC 2～C 6のアルケニル基が酸素原子を介して結合したものを表す。また、幾何異性体がある場合、E体またはZ体のどちらか一方のみ、あるいはE体とZ体との任意の割合の混合物であり、指定される炭素数の範囲であれば、特に制限されることはない。C 2～C 6のアルケニルオキシ基の具体例として、ビニルオキシ基、1-プロペニルオキシ基、アリルオキシ基、1-ブテニルオキシ基、2-ブテニルオキシ基、3-ブテニルオキシ基、1-ペンテニルオキシ基、2-ペンテニルオキシ基、3-ペンテニルオキシ基、4-ペンテニルオキシ基、3-メチル-2-ブテニルオキシ基、1-ヘキセニルオキシ基、2-ヘキセニルオ

キシ基、3-ヘキセニルオキシ基、4-ヘキセニルオキシ基、5-ヘキセニルオキシ基、4-メチル-3-ペンテニルオキシ基、3-メチル-2-ペンテニルオキシ基等が挙げられる。

[0071] C2～C6のハロアルケニルオキシ基とは、前記のC2～C6のアルケニルオキシ基における水素原子が1個または2個以上のハロゲン原子によって任意に置換されたものを表す。2個以上のハロゲン原子で置換される場合、それらのハロゲン原子は同一または異なっていてよく、その置換数は置換基として存在することができる限り特に制限はない。C2～C6のハロアルケニルオキシ基の具体例として、2-フルオロビニルオキシ基、2,2-ジフルオロビニルオキシ基、2,2-ジクロロビニルオキシ基、3-フルオロアリルオキシ基、3,3-ジフルオロアリルオキシ基、3,3-ジクロロアリルオキシ基、4,4-ジフルオロ-3-ブテニルオキシ基、5,5-ジフルオロ-4-ペンテニルオキシ基、6,6-ジフルオロ-5-ヘキセニルオキシ基等が挙げられる。

[0072] C3～C6のアルキニルオキシ基とは、前記のC2～C6のアルキニル基のうち、C3～C6のアルキニル基が酸素原子を介して結合したのものを表す。C3～C6のアルキニルオキシ基の具体例として、プロパルギルオキシ基、2-ブチニルオキシ基、3-ブチニルオキシ基、2-ペンチニルオキシ基、3-ペンチニルオキシ基、4-ペンチニルオキシ基、1,1-ジメチル-2-プロピニルオキシ基、2-ヘキシニルオキシ基、3-ヘキシニルオキシ基、4-ヘキシニルオキシ基、5-ヘキシニルオキシ基等が挙げられる。

[0073] C3～C6のハロアルキニルオキシ基とは、前記のC3～C6のアルキニルオキシ基における水素原子が1個または2個以上のハロゲン原子によって任意に置換されたものを表す。2個以上のハロゲン原子で置換される場合、それらのハロゲン原子は同一または異なっていてよく、その置換数は置換基として存在することができる限り特に制限はない。C3～C6のハロアルキニルオキシ基の具体例として、1,1-ジフルオロ-2-プロピニルオキシ基、4,4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、4-クロロ-4,4-ジ

フルオロ-2-ブチニルオキシ基、4-ブロモ-4, 4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、4, 4, 4-トリフルオロ-2-ブチニルオキシ基、5, 5-ジフルオロ-3-ペンチニルオキシ基、5-クロロ-5, 5-ジフルオロ-3-ペンチニルオキシ基、5-ブロモ-5, 5-ジフルオロ-3-ペンチニルオキシ基、5, 5, 5-トリフルオロ-3-ペンチニルオキシ基、6, 6-ジフルオロ-4-ヘキシニルオキシ基、6-クロロ-6, 6-ジフルオロ-4-ヘキシニルオキシ基、6-ブロモ-6, 6-ジフルオロ-4-ヘキシニルオキシ基、6, 6, 6-トリフルオロ-4-ヘキシニルオキシ基等が挙げられる。

[0074] C2～C6のアルコキシアルコキシ基とは、前記のC1～C6のアルコキシ基のうちC1～C5のアルコキシ基における水素原子が、1個または2個以上のC1～C5アルコキシ基で任意に置換されたものを表す。炭素数の総和が指定される炭素数の範囲であれば、特に限定されることはない。C2～C6のアルコキシアルコキシ基の具体例として、メトキシメトキシ基、エトキシメトキシ基、プロピルオキシメトキシ基、イソプロピルオキシメトキシ基、メトキシエトキシ基、エトキシエトキシ基、プロピルオキシエトキシ基、イソプロピルオキシエトキシ基、メトキシプロピルオキシ基、エトキシプロピルオキシ基、プロピルオキシプロピルオキシ基、イソプロピルオキシプロピルオキシ基等が挙げられる。

[0075] アリール基とは、水素原子および炭素原子より構成される環状芳香族置換基を表す。アリール基の具体例として、フェニル基、ナフチル基等が挙げられる。

[0076] ヘテロアリール基とは、窒素原子、酸素原子および硫黄原子からなる群より選ばれ、少なくとも1つのヘテロ原子を環の構成原子として含む環状芳香族置換基を表す。ヘテロアリール基の具体例として、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、テトラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、フリル基、ピロリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、イソ

オキサゾリル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、テトラゾリル基等が挙げられる。

[0077] アリールオキシ基とは、前記のアリール基が酸素原子を介して結合したものを表す。アリールオキシ基の具体例として、フェノキシ基、ナフチルオキシ基等が挙げられる。

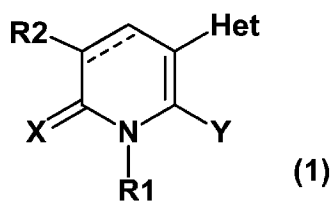
[0078] ヘテロアリールオキシ基とは、前記のヘテロアリール基が酸素原子を介して結合したものを表す。ヘテロアリールオキシ基の具体例として、ピリジルオキシ基、ピリダジニルオキシ基、ピリミジニルオキシ基、ピラジニルオキシ基、トリアジニルオキシ基、テトラジニルオキシ基、チエニルオキシ基、チアゾリルオキシ基、イソチアゾリルオキシ基、チアジアゾリルオキシ基、フリルオキシ基、ピロリルオキシ基、イミダゾリルオキシ基、ピラゾリルオキシ基、オキサゾリルオキシ基、イソオキサゾリルオキシ基、トリアゾリルオキシ基、オキサジアゾリルオキシ基、チアジアゾリルオキシ基、テトラゾリルオキシ基等が挙げられる。

[0079] アラルキルオキシ基とは、C 1 ～ C 3 のアルキル基における水素原子がフェニル基、ナフチル基等のアリール基で置換されたアラルキル基が、酸素原子を介して結合したものを表す。アラルキルオキシ基の具体例として、ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基、フェニルプロピルオキシ基、ナフタレニルメトキシ基、ナフタレニルエトキシ基、ナフタレニルプロポキシ基等が挙げられる。

[0080] 1 ～ 2 個の酸素原子を含む 3 ～ 6 員環の基の具体例として、1, 2-エポキシエタニル基、オキセタニル基、オキソラニル基、オキサニル基、1, 3-ジオキソラニル基、1, 3-ジオキサニル基、1, 4-ジオキサニル基等が挙げられる。

[0081] 本発明のピリドン化合物は、下記式（1）で表される化合物とその塩を包含する。

[化11]



[0082] 以下、式（１）について説明する。

[0083] 式（１）におけるＲ１は、水酸基、シアノ基、置換基Ａで適宜置換されてもよいＣ１～Ｃ６のアルキル基、Ｃ１～Ｃ６のハロアルキル基、置換基Ａで適宜置換されてもよいＣ３～Ｃ８のシクロアルキル基、置換基Ａで適宜置換されてもよいＣ２～Ｃ６のアルケニル基、Ｃ２～Ｃ６のハロアルケニル基、置換基Ａで適宜置換されてもよいＣ２～Ｃ６のアルキニル基、Ｃ２～Ｃ６のハロアルキニル基、置換基Ａで適宜置換されてもよいＣ１～Ｃ６のアルコキシ基、Ｃ１～Ｃ６のハロアルコキシ基、置換基Ａで適宜置換されてもよいＣ３～Ｃ８のシクロアルコキシ基、置換基Ａで適宜置換されてもよいＣ２～Ｃ６のアルケニルオキシ基、Ｃ２～Ｃ６のハロアルケニルオキシ基、置換基Ａで適宜置換されてもよいＣ３～Ｃ６のアルキニルオキシ基、Ｃ３～Ｃ６のハロアルキニルオキシ基、またはＲ_aＲ_bＮ－（ここで、Ｒ_aおよびＲ_bは、それぞれ独立していて、水素原子、置換基Ｂで適宜置換されてもよいＣ１～Ｃ６のアルキル基、Ｃ１～Ｃ６のハロアルキル基、またはＣ３～Ｃ８のシクロアルキル基を表すか、あるいはＲ_aおよびＲ_bは、結合する窒素原子と一緒にあって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、またはアゾカニル基を形成するものを表す。）を表す。

[0084] 中でもＲ１は、置換基Ａで適宜置換されてもよいＣ１～Ｃ６のアルキル基、Ｃ１～Ｃ６のハロアルキル基、置換基Ａで適宜置換されてもよいＣ２～Ｃ６のアルケニル基、Ｃ２～Ｃ６のハロアルケニル基、置換基Ａで適宜置換されてもよいＣ２～Ｃ６のアルキニル基、Ｃ２～Ｃ６のハロアルキニル基、またはＲ_aＲ_bＮ－（ここで、Ｒ_aおよびＲ_bは、前記と同義である。）が好

ましく、

[0085] 特に、置換基Aで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、または $R^a R^b N-$ （ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。）が好ましく、

[0086] さらに、C1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、または $R^a R^b N-$ （ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。）が好ましい。

[0087] 式（1）の R_1 には、水酸基、およびシアノ基が含まれる。

[0088] 式（1）の R_1 における「置換基Aで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基」のC1～C6のアルキル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、またはイソブチル基であり、さらに好ましくは、メチル基、エチル基、またはプロピル基であり、特に好ましくは、メチル基、またはエチル基である。置換基Aを有する場合、C1～C6のアルキル基における水素原子が、置換基Aによって任意に置換される。

[0089] 式（1）の R_1 における「C1～C6のハロアルキル基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、2-フルオロエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、3, 3-ジフルオロプロピル基、または3, 3, 3-トリフルオロプロピル基であり、さらに好ましくは、2-フルオロエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、または2, 2, 2-トリフルオロエチル基であり、特に好ましくは、2, 2-ジフルオロエチル基、または2, 2, 2-トリフルオロエチル基である。

[0090] 式（1）の R_1 における「置換基Aで適宜置換されてもよいC3～C8のシクロアルキル基」のC3～C8のシクロアルキル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、またはシクロヘキシル基であり、さらに好ましくは、シクロプロピル基、またはシクロブチル基である。置換基Aを有する場合、C3～C8のシクロアルキル基における水素原子が、置換基Aによって任意に置換される。

- [0091] 式(1)のR₁における「置換基Aで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルケニル基」のC₂～C₆のアルケニル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ビニル基、1-プロペニル基、またはアリル基であり、さらに好ましくは、ビニル基、またはアリル基である。置換基Aを有する場合、C₂～C₆のアルケニル基における水素原子が、置換基Aによって任意に置換される。
- [0092] 式(1)のR₁における「C₂～C₆のハロアルケニル基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、2-フルオロビニル基、2,2-ジフルオロビニル基、3-フルオロアリル基、または3,3-ジフルオロアリル基であり、さらに好ましくは、2-フルオロビニル基、または2,2-ジフルオロビニル基である。
- [0093] 式(1)のR₁における「置換基Aで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルキニル基」のC₂～C₆のアルキニル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、プロパルギル基、2-ブチニル基、または3-ブチニル基であり、さらに好ましくは、プロパルギル基である。置換基Aを有する場合、C₂～C₆のアルキニル基における水素原子が、置換基Aによって任意に置換される。
- [0094] 式(1)のR₁における「C₂～C₆のハロアルキニル基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、4,4-ジフルオロ-2-ブチニル基、4-クロロ-4,4-ジフルオロ-2-ブチニル基、4-ブロモ-4,4-ジフルオロ-2-ブチニル基、または4,4,4-トリフルオロ-2-ブチニル基であり、さらに好ましくは、4,4-ジフルオロ-2-ブチニル基、または4,4,4-トリフルオロ-2-ブチニル基である。
- [0095] 式(1)のR₁における「置換基Aで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルコキシ基」のC₁～C₆のアルコキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブトキシ基、またはイソブトキシ基であり、さらに好ましくは、メトキシ基、またはエトキシ基である。置換基Aを有する場合、C₁～C₆の

アルコキシ基における水素原子が、置換基Aによって任意に置換される。

[0096] 式(1)のR₁における「C₁～C₆のハロアルコキシ基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、3, 3-ジフルオロプロピルオキシ基、または3, 3, 3-トリフルオロプロピルオキシ基であり、さらに好ましくは、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、または2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基である。

[0097] 式(1)のR₁における「置換基Aで適宜置換されてもよいC₃～C₈のシクロアルコキシ基」のC₃～C₈のシクロアルコキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、シクロプロピルオキシ基、シクロブトキシ基、シクロペンチルオキシ基、またはシクロヘキシルオキシ基であり、さらに好ましくは、シクロプロピルオキシ基、またはシクロブトキシ基である。置換基Aを有する場合、C₃～C₈のシクロアルコキシ基における水素原子が、置換基Aによって任意に置換される。

[0098] 式(1)のR₁における「置換基Aで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルケニルオキシ基」のC₂～C₆のアルケニルオキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ビニルオキシ基、1-プロペニルオキシ基、またはアリルオキシ基であり、さらに好ましくは、アリルオキシ基である。置換基Aを有する場合、C₂～C₆のアルケニルオキシ基における水素原子が、置換基Aによって任意に置換される。

[0099] 式(1)のR₁における「C₂～C₆のハロアルケニルオキシ基」とは、前記の定義と同義であり、好ましくは、2-フルオロビニルオキシ基、2, 2-ジフルオロビニルオキシ基、3-フルオロアリルオキシ基、または3, 3-ジフルオロアリルオキシ基であり、さらに好ましくは、2-フルオロビニルオキシ基、または2, 2-ジフルオロビニルオキシ基である。

[0100] 式(1)のR₁における「置換基Aで適宜置換されてもよいC₃～C₆のアルキニルオキシ基」のC₃～C₆のアルキニルオキシ基は、前記の定義と

同義であり、好ましくは、プロパルギルオキシ基、2-ブチニルオキシ基、または3-ブチニルオキシ基であり、さらに好ましくは、プロパルギルオキシ基である。置換基Aを有する場合、C3～C6のアルキニルオキシ基における水素原子が、置換基Aによって任意に置換される。

[0101] 式(1)のR1における「C3～C6のハロアルキニルオキシ基」とは、前記の定義と同義であり、好ましくは、4,4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、4-クロロ-4,4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、4-ブロモ-4,4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、または4,4,4-トリフルオロ-2-ブチニルオキシ基であり、さらに好ましくは、4,4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、または4,4,4-トリフルオロ-2-ブチニルオキシ基である。

[0102] 式(1)のR1における「RaRbN-」(ここで、RaおよびRbは、それぞれ独立して、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、またはC3～C8のシクロアルキル基を表すか、あるいはRaおよびRbは、結合する窒素原子と一緒にあって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、またはアゾカニル基を形成するものを表す。)の各用語は、前記の定義と同義である。なお、「置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基」に関しては、置換基Bを有する場合、C1～C6のアルキル基における水素原子が、置換基Bによって任意に置換される。RaおよびRbとして、好ましくは、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、C3～C8のシクロアルキル基、ピロリジニル基、またはピペリジニル基であり、さらに好ましくは、水素原子、または置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基である。「RaRbN-」として、好ましくは、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、(メトキシメチル)アミノ基、(2-メトキシエチル)アミノ基、(シアノメチル)アミノ基、(2-シアノエチル)アミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジエチルア

ミノ基、(メトキシメチル)メチルアミノ基、(2-メトキシエチル)メチルアミノ基、(シアノメチル)メチルアミノ基、(2-シアノエチル)メチルアミノ基、2, 2-ジフルオロエチルアミノ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ基、シクロプロピルアミノ基、(シクロプロピル)メチルアミノ基、ピロリジニル基、またはピペリジニル基であり、さらに好ましくは、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、またはジエチルアミノ基であり、特に好ましくは、アミノ基、メチルアミノ基、またはジメチルアミノ基である。

[0103] 式(1)中の R^2 は、水素原子、ニトロ基、ハロゲン原子、置換基Aで適宜置換されてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ のハロアルキル基、置換基Aで適宜置換されてもよい $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル基、置換基Aで適宜置換されてもよい $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ のハロアルケニル基、置換基Aで適宜置換されてもよい $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基、 $C_2 \sim C_6$ のハロアルキニル基、置換基Aで適宜置換されてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ のハロアルコキシ基、置換基Aで適宜置換されてもよい $C_3 \sim C_8$ のシクロアルコキシ基、置換基Aで適宜置換されてもよい $C_2 \sim C_6$ のアルケニルオキシ基、 $C_2 \sim C_6$ のハロアルケニルオキシ基、置換基Aで適宜置換されてもよい $C_3 \sim C_6$ のアルキニルオキシ基、 $C_3 \sim C_6$ のハロアルキニルオキシ基、 R^c-L- (ここで、 R^c は、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、または $C_1 \sim C_6$ のハロアルキル基を表し、 L は、 S 、 SO 、または SO_2 を表す。)、または $R^{x1}C(=O)-$ (ここで、 R^{x1} は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ のハロアルキル基、 $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ のアルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ のハロアルコキシ基、 $C_3 \sim C_8$ のシクロアルコキシ基、または R^aR^bN- (ここで、 R^a および R^b は前記と同義である。))を表す。))を表す。

[0104] 中でも、 R^2 は、水素原子、ハロゲン原子、置換基Aで適宜置換されてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ のハロアルキル基、置換基Aで適

宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、C 2～C 6のハロアルキニル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、C 1～C 6のハロアルコキシ基、置換基Aで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニルオキシ基、置換基Aで適宜置換されてもよいC 3～C 6のアルキニルオキシ基、 R_c-L- （ここで、 R_c およびLは、前記と同義である。）
、または $R_{x1}C(=O)-$ （ここで、 R_{x1} は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、C 3～C 8のシクロアルキル基、C 1～C 6のアルコキシ基、C 1～C 6のハロアルコキシ基、C 3～C 8のシクロアルコキシ基、または R_aR_bN- （ここで、 R_a および R_b は前記と同義である。）を表す。）が好ましく、

特に、水素原子、ハロゲン原子、置換基Aで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、または $R_{x1}C(=O)-$ （ここで、 R_{x1} は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、C 3～C 8のシクロアルキル基、C 1～C 6のアルコキシ基、C 1～C 6のハロアルコキシ基、C 3～C 8のシクロアルコキシ基、または R_aR_bN- （ここで、 R_a および R_b は前記と同義である。）を表す。）が好ましく、

さらに、水素原子、ハロゲン原子、置換基Aで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、または置換基Aで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基が好ましい。

[0105] 式(1)の R_2 には、水素原子、およびニトロ基が含まれる。

[0106] 式(1)の R_2 におけるハロゲン原子は、前記の定義と同義であり、好ましくはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、またはヨウ素原子である。

[0107] 式(1)の R_2 における「置換基Aで適宜置換されてもよいC 1～C 6の

アルキル基」のC 1～C 6のアルキル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、またはイソブチル基であり、さらに好ましくは、メチル基、またはエチル基であり、特に好ましくは、メチル基である。置換基Aを有する場合、C 1～C 6のアルキル基における水素原子が、置換基Aによって任意に置換される。

[0108] 式(1)のR²における「C 1～C 6のハロアルキル基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、3, 3-ジフルオロプロピル基、または3, 3, 3-トリフルオロプロピル基であり、さらに好ましくは、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、または2, 2, 2-トリフルオロエチル基であり、特に好ましくは、ジフルオロメチル基、またはトリフルオロメチル基である。

[0109] 式(1)のR²における「置換基Aで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルキル基」のC 3～C 8のシクロアルキル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、またはシクロヘキシル基であり、さらに好ましくは、シクロプロピル基、またはシクロブチル基である。置換基Aを有する場合、C 3～C 8のシクロアルキル基における水素原子が、置換基Aによって任意に置換される。

[0110] 式(1)のR²における「置換基Aで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニル基」のC 2～C 6のアルケニル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ビニル基、1-プロペニル基、アリル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、または3-ブテニル基であり、さらに好ましくは、ビニル基、1-プロペニル基、またはアリル基である。置換基Aを有する場合、C 2～C 6のアルケニル基における水素原子が、置換基Aによって任意に置換される。

[0111] 式(1)のR²における「C 2～C 6のハロアルケニル基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、2-フルオロビニル基、2, 2-ジフルオロ

ビニル基、2, 2-ジクロロビニル基、3-フルオロアリル基、3, 3-ジフルオロアリル基、または3, 3-ジクロロアリル基であり、さらに好ましくは、2-フルオロビニル基、または2, 2-ジフルオロビニル基である。

[0112] 式(1)のR²における「置換基Aで適宜置換されてもよいC₂~C₆のアルキニル基」のC₂~C₆のアルキニル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、エチニル基、1-プロピニル基、プロパルギル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、または3-ブチニル基であり、さらに好ましくは、エチニル基、1-プロピニル基、またはプロパルギル基であり、特に好ましくは、エチニル基である。置換基Aを有する場合、C₂~C₆のアルキニル基における水素原子が、置換基Aによって任意に置換される。

[0113] 式(1)のR²における「C₂~C₆のハロアルキニル基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、3, 3-ジフルオロ-1-プロピニル基、3, 3, 3-トリフルオロ-1-プロピニル基、4, 4-ジフルオロ-1-ブチニル基、4, 4, 4-トリフルオロ-1-ブチニル基、または4, 4, 4-トリフルオロ-2-ブチニル基であり、さらに好ましくは、3, 3-ジフルオロ-1-プロピニル基、または3, 3, 3-トリフルオロ-1-プロピニル基である。

[0114] 式(1)のR²における「置換基Aで適宜置換されてもよいC₁~C₆のアルコキシ基」のC₁~C₆のアルコキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブトキシ基、またはイソブトキシ基であり、さらに好ましくは、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、またはイソプロピルオキシ基であり、特に好ましくは、メトキシ基である。置換基Aを有する場合、C₁~C₆のアルコキシ基における水素原子が、置換基Aによって任意に置換される。

[0115] 式(1)のR²における「C₁~C₆のハロアルコキシ基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ

基、3, 3-ジフルオロプロピルオキシ基、または3, 3, 3-トリフルオロプロピルオキシ基であり、さらに好ましくは、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、または2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基である。

[0116] 式(1)のR²における「置換基Aで適宜置換されてもよいC₃~C₈のシクロアルコキシ基」のC₃~C₈のシクロアルコキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、シクロプロピルオキシ基、シクロブトキシ基、シクロペンチルオキシ基、またはシクロヘキシルオキシ基であり、さらに好ましくは、シクロプロピルオキシ基、またはシクロブトキシ基である。置換基Aを有する場合、C₃~C₈のシクロアルコキシ基における水素原子が、置換基Aによって任意に置換される。

[0117] 式(1)のR²における「置換基Aで適宜置換されてもよいC₂~C₆のアルケニルオキシ基」のC₂~C₆のアルケニルオキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ビニルオキシ基、1-プロペニルオキシ基、アリルオキシ基、1-ブテニルオキシ基、2-ブテニルオキシ基、または3-ブテニルオキシ基であり、さらに好ましくは、ビニルオキシ基、1-プロペニルオキシ基、またはアリルオキシ基である。置換基Aを有する場合、C₂~C₆のアルケニルオキシ基における水素原子が、置換基Aによって任意に置換される。

[0118] 式(1)のR²における「C₂~C₆のハロアルケニルオキシ基」は、前記の定義と同義であり、2-フルオロビニルオキシ基、2, 2-ジフルオロビニルオキシ基、2, 2-ジクロロビニルオキシ基、3-フルオロアリルオキシ基、3, 3-ジフルオロアリルオキシ基、または3, 3-ジクロロアリルオキシ基であり、さらに好ましくは、2-フルオロビニルオキシ基、または2, 2-ジフルオロビニルオキシ基である。

[0119] 式(1)のR²における「置換基Aで適宜置換されてもよいC₃~C₆のアルキニルオキシ基」のC₃~C₆のアルキニルオキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、プロパルギルオキシ基、2-ブチニルオキシ基、

または3-ブチニルオキシ基であり、さらに好ましくは、プロパルギルオキシ基である。置換基Aを有する場合、C3～C6のアルキニルオキシ基における水素原子が、置換基Aによって任意に置換される。

[0120] 式(1)のR²における「C3～C6のハロアルキニルオキシ基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、4,4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、4-クロロ-4,4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、4-ブromo-4,4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、または4,4,4-トリフルオロ-2-ブチニルオキシ基であり、さらに好ましくは、4,4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、または4,4,4-トリフルオロ-2-ブチニルオキシ基である。

[0121] 式(1)のR²における「R^c-L-」(ここで、R^cは、C1～C6のアルキル基、またはC1～C6のハロアルキル基を表し、Lは、S、SO、またはSO₂を表す。)の各用語は、前記と同義である。「R^c-L-」として、好ましくは、メチルチオ基、メタンスルフィニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメチルチオ基、トリフルオロメタンスルフィニル基、またはトリフルオロメタンスルホニル基であり、さらに好ましくは、メチルチオ基、メタンスルフィニル基、またはメタンスルホニル基である。

[0122] 式(1)のR²における「R^{x1}C(=O)-」(ここで、R^{x1}は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、C3～C8のシクロアルキル基、C1～C6のアルコキシ基、C1～C6のハロアルコキシ基、C3～C8のシクロアルコキシ基、またはR^aR^bN- (ここで、R^aおよびR^bは前記と同義である。))を表す。)の各用語は、前記の定義と同義である。なお、「置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基」に関しては、置換基Bを有する場合、C1～C6のアルキル基における水素原子が、置換基Bによって任意に置換される。R^{x1}として、好ましくは、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、またはC1～C6のアルコキシ基であり、さらに好ましくは、水素原子、置換基

Bで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、またはC 1～C 6のアルコキシ基であり、特に好ましくは、水素原子である。「R x 1 C (=O) -」として、ホルミル基、アセチル基、メトキシアセチル基、シアノアセチル基、プロピオニル基、ジフルオロアセチル基、トリフルオロアセチル基、シクロプロパンカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、2, 2-ジフルオロエトキシカルボニル基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル基、3, 3, 3-トリフルオロプロピルオキシカルボニル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、アミノカルボニル基、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニル基、(メトキシメチル)アミノカルボニル基、(2-メトキシエチル)アミノカルボニル基、(シアノメチル)アミノカルボニル基、(2-シアノエチル)アミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、エチルメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、(メトキシメチル)メチルアミノカルボニル基、(2-メトキシエチル)メチルアミノカルボニル基、(シアノメチル)メチルアミノカルボニル基、(2-シアノエチル)メチルアミノカルボニル基、2, 2-ジフルオロエチルアミノカルボニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノカルボニル基、シクロプロピルアミノカルボニル基、(シクロプロピル)メチルアミノカルボニル基、ピロリジニルカルボニル基、およびピペリジニルカルボニル基等が挙げられる。「R x 1 C (=O) -」として好ましくは、ホルミル基、アセチル基、メトキシアセチル基、シアノアセチル基、プロピオニル基、ジフルオロアセチル基、トリフルオロアセチル基、メトキシカルボニル基、またはエトキシカルボニル基であり、さらに好ましくは、ホルミル基、アセチル基、メトキシアセチル基、シアノアセチル基、メトキシカルボニル基、またはエトキシカルボニル基であり、特に好ましくは、ホルミル基である。

[0123] 式(1)中、Hetは、5～6員の複素環基、または8～10員の複素環基を表す。

[0124] 該5～6員の複素環基、または該8～10員の複素環基は、R3が適宜0

～6置換する（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）。

[0125] 5～6員の複素環基の具体例としては、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、テトラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、チアトリアゾリル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ペンタゾリル基、フリル基、オキサゾリル基、または1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基等が挙げられる。

[0126] 8～10員の複素環基の具体例としては、インドリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフリル基、イソベンゾフリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチエニル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾイソチアゾリル基、ベンゾチアジアゾリル基、インドリジニル基、イミダゾピリジル基、ピラゾロピリジル基、トリアゾロピリジル基、ピロロピリミジニル基、イミダゾピリミジニル基、ピラゾロピリミジニル基、トリアゾロピリミジニル基、ピロロピラジニル基、イミダゾピラジニル基、ピラゾロピラジニル基、トリアゾロピラジニル基、キノリル基、イソキノリル基、シノリル基、フタラジニル基、キノキサリニル基、キナゾリニル基、またはナフチリジニル基等が挙げられる。

[0127] 中でも、Hetは、5～6員の複素環基が好ましく、具体的には、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、テトラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、チアトリアゾリル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ペンタゾリル基、フリル基、オキサゾリル基、または1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基が好ましく、

特に、ピリジル基、チエニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、オキサゾリル基、または1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基が好ましい。

さらに、ピリジル基、チエニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾ

リル基、トリアゾリル基、オキサゾリル基、または1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基が好ましい。

[0128] 該ピリジル基、該ピリダジニル基、該ピリミジニル基、該ピラジニル基、該トリアジニル基、または該テトラジニル基は、R³が適宜0～4置換する。（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）

[0129] 該チエニル基、該チアゾリル基、該イソチアゾリル基、該チアジアゾリル基、または該チアトリアゾリル基は、R³が適宜0～3置換する。（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）

[0130] 該ピロリル基、該ピラゾリル基、該イミダゾリル基、該トリアゾリル基、該テトラゾリル基、または該ペンタゾリル基は、R³が適宜0～4置換する。（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）

[0131] 該フリル基、または該オキサゾリル基は、R³が適宜0～3置換する。（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）

[0132] 該インドリル基、該イソインドリル基、該インダゾリル基、該ベンゾイミダゾリル基、または該ベンゾトリアゾリル基は、R³が適宜0～6置換する。（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）

[0133] 該ベンゾフリル基、該イソベンゾフリル基、または該ベンゾオキサゾリル基は、R³が適宜0～5置換する。（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）

[0134] 該ベンゾチエニル基、該ベンゾチアゾリル基、該ベンゾイソチアゾリル基、または該ベンゾチアジアゾリル基は、R³が適宜0～5置換する。（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）

[0135] 該インドリジニル基、該イミダゾピリジル基、該ピラゾロピリジル基、ま

たは該トリアゾロピリジル基は、R³が適宜0～6置換する。（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）

[0136] 該ピロロピリミジニル基、該イミダゾピリミジニル基、該ピラゾロピリミジニル基、該トリアゾロピリミジニル基、該ピロロピラジニル基、該イミダゾピラジニル基、該ピラゾロピラジニル基、または該トリアゾロピラジニル基は、R³が適宜0～5置換する。（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）

[0137] 該キノリル基、該イソキノリル基、該シノリル基、該フタラジニル基、該キノキサリニル基、該キナゾリニル基、または該ナフチリジニル基は、R³が適宜0～6置換する。（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）

[0138] R³は、水酸基、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、置換基Cで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基、C¹～C⁶のハロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC³～C⁸のシクロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC²～C⁶のアルケニル基、C²～C⁶ハロアルケニル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC²～C⁶のアルキニル基、C²～C⁶のハロアルキニル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルコキシ基、C¹～C⁶のハロアルコキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC³～C⁸のシクロアルコキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC²～C⁶のアルケニルオキシ基、C²～C⁶のハロアルケニルオキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC³～C⁶のアルキニルオキシ基、C³～C⁶のハロアルキニルオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基、置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基、置換基Dで適宜置換されてもよいアリールオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリールオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキルオキシ基、R^aR^bN-（ここで、R^aおよびR^bは、前記と同義である。）、R^c-L-（ここで、R^cおよびLは、前記と同義である。）、R^{x1}C(=O)-（ここでR^{x1}は、前記と同義である。）、R^{x1}C(=O)O-（ここで

$R \times 1$ は、前記と同義である。)、 $R \times 2 C(=O)N(R \times 3)-$ (ここで、 $R \times 2$ は、水素原子、置換基 B で適宜置換されてもよい $C1 \sim C6$ のアルキル基、 $C1 \sim C6$ のハロアルキル基、 $C3 \sim C8$ のシクロアルキル基、 $C1 \sim C6$ のアルコキシ基、 $C1 \sim C6$ のハロアルコキシ基、 $C3 \sim C8$ のシクロアルコキシ基、または $R_a R_b N-$ (ここで、 R_a および R_b は、前記と同義である。)) を表し、 $R \times 3$ は、水素原子、置換基 B で適宜置換されてもよい $C1 \sim C6$ のアルキル基、 $C1 \sim C6$ のハロアルキル基、または $C3 \sim C8$ のシクロアルキル基を表す。)、 $R \times 4 R \times 5 C=N-O-$ (ここで、 $R \times 4$ および $R \times 5$ は、それぞれ独立して、水素原子、置換基 B で適宜置換されてもよい $C1 \sim C6$ のアルキル基、 $C1 \sim C6$ のハロアルキル基、 $C3 \sim C8$ のシクロアルキル基、 $C1 \sim C6$ のアルコキシ基、 $C1 \sim C6$ のハロアルコキシ基、 $C3 \sim C8$ のシクロアルコキシ基、または $R_a R_b N-$ (ここで、 R_a および R_b は、前記と同義である。)) を表す。)、または 1 ~ 2 個の酸素原子を含む 3 ~ 6 員環の基を表す。

[0139] 中でも、 R_3 は、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、置換基 C で適宜置換されてもよい $C1 \sim C6$ のアルキル基、 $C1 \sim C6$ のハロアルキル基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C3 \sim C8$ のシクロアルキル基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C2 \sim C6$ のアルケニル基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C2 \sim C6$ のアルキニル基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C1 \sim C6$ のアルコキシ基、 $C1 \sim C6$ のハロアルコキシ基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C3 \sim C8$ のシクロアルコキシ基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C2 \sim C6$ のアルケニルオキシ基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C3 \sim C6$ のアルキニルオキシ基、 $R_a R_b N-$ (ここで、 R_a および R_b は、前記と同義である。)、 R_c-L- (ここで、 R_c および L は、前記と同義である。)、 $R \times 1 C(=O)-$ (ここで、 $R \times 1$ は、前記と同義である。)、 $R \times 1 C(=O)O-$ (ここで $R \times 1$ は、前記と同義である。)、または $R \times 2 C(=O)N(R \times 3)-$ (ここで、 $R \times 2$ および $R \times 3$ は、前記と同義である。)) が好ましく、

[0140] 特に、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、 $R^a R^b N-$ （ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。）、 $R^{x1}C(=O)-$ （ここで R^{x1} は、前記と同義である。）、または $R^{x2}C(=O)N(R^{x3})-$ （ここで、 R^{x2} および R^{x3} は、前記と同義である。）

が好ましく、

[0141] さらに、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、 $R^a R^b N-$ （ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。）、または、 $R^{x1}C(=O)-$ （ここで R^{x1} は、前記と同義である。）が好ましい。

[0142] 式（1）の R^3 には、水酸基、シアノ基、およびニトロ基が含まれる。

[0143] 式（1）の R^3 におけるハロゲン原子は、前記の定義と同義であり、好ましくはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、またはヨウ素原子である。

[0144] 式（1）の R^3 における「置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基」のC 1～C 6のアルキル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、またはイソブチル基であり、さらに好ましくは、メチル基、エチル基、またはプロピル基であり、特に好ましくは、メチル基である。置換基Cを有する場合、C 1～C 6のアルキル基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0145] 式（1）の R^3 における「C 1～C 6のハロアルキル基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、モノフルオロメチル基、モノクロロメチル基、モノブロモメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、3, 3-ジフルオロプロピル基、または3, 3, 3-トリフルオロプロピル基であり、さらに好ましくは、モノブロモメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロ

メチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、または2, 2, 2-トリフルオロエチル基であり、特に好ましくは、モノブロモメチル基、ジフルオロメチル基、またはトリフルオロメチル基である。

[0146] 式(1)のR³における「置換基Cで適宜置換されてもよいC₃~C₈のシクロアルキル基」のC₃~C₈のシクロアルキル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、またはシクロヘキシル基であり、さらに好ましくは、シクロプロピル基、またはシクロブチル基である。置換基Cを有する場合、C₃~C₈のシクロアルキル基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0147] 式(1)のR³における「置換基Cで適宜置換されてもよいC₂~C₆のアルケニル基」のC₂~C₆のアルケニル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ビニル基、1-プロペニル基、アリル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、または3-ブテニル基であり、さらに好ましくは、ビニル基、1-プロペニル基、またはアリル基である。置換基Cを有する場合、C₂~C₆のアルケニル基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0148] 式(1)のR³における「C₂~C₆のハロアルケニル基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、2-フルオロビニル基、2, 2-ジフルオロビニル基、2, 2-ジクロロビニル基、3-フルオロアリル基、3, 3-ジフルオロアリル基、または3, 3-ジクロロアリル基であり、さらに好ましくは、2-フルオロビニル基、または2, 2-ジフルオロビニル基である。

[0149] 式(1)のR³における「置換基Cで適宜置換されてもよいC₂~C₆のアルキニル基」のC₂~C₆のアルキニル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、エチニル基、1-プロピニル基、プロパルギル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、または3-ブチニル基であり、さらに好ましくは、エチニル基、1-プロピニル基、またはプロパルギル基である。置換基Cを有する場合、C₂~C₆のアルキニル基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0150] 式(1)のR₃における「C₂～C₆のハロアルキニル基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、3, 3-ジフルオロ-1-プロピニル基、3, 3, 3-トリフルオロ-1-プロピニル基、4, 4-ジフルオロ-1-ブチニル基、4, 4, 4-トリフルオロ-1-ブチニル基、4, 4-ジフルオロ-2-ブチニル基、4, 4, 4-トリフルオロ-2-ブチニル基、または4, 4, 4-トリフルオロ-2-ブチニル基であり、さらに好ましくは、3, 3-ジフルオロ-1-プロピニル基、または3, 3, 3-トリフルオロ-1-プロピニル基である。

[0151] 式(1)のR₃における「置換基Cで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルコキシ基」のC₁～C₆のアルコキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブトキシ基、またはイソブトキシ基であり、さらに好ましくは、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、またはイソプロピルオキシ基であり、特に好ましくは、メトキシ基である。置換基Cを有する場合、C₁～C₆のアルコキシ基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0152] 式(1)のR₃における「C₁～C₆のハロアルコキシ基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、3, 3-ジフルオロプロピルオキシ基、または3, 3, 3-トリフルオロプロピルオキシ基であり、さらに好ましくは、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、または2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基である。

[0153] 式(1)のR₃における「置換基Cで適宜置換されてもよいC₃～C₈のシクロアルコキシ基」のC₃～C₈のシクロアルコキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、シクロプロピルオキシ基、シクロブトキシ基、シクロペンチルオキシ基、またはシクロヘキシルオキシ基であり、さらに好ましくは、シクロプロピルオキシ基、またはシクロブトキシ基である。置換基Cを有する場合、C₃～C₈のシクロアルコキシ基における水素原子が、置

置換基Cによって任意に置換される。

[0154] 式(1)のR₃における「置換基Cで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルケニルオキシ基」のC₂～C₆のアルケニルオキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ビニルオキシ基、1-プロペニルオキシ基、アリルオキシ基、1-ブテニルオキシ基、2-ブテニルオキシ基、または3-ブテニルオキシ基であり、さらに好ましくは、ビニルオキシ基、1-プロペニルオキシ基、またはアリルオキシ基である。置換基Cを有する場合、C₂～C₆のアルケニルオキシ基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0155] 式(1)のR₃における「C₂～C₆のハロアルケニルオキシ基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、2-フルオロビニルオキシ基、2,2-ジフルオロビニルオキシ基、2,2-ジクロロビニルオキシ基、3-フルオロアリルオキシ基、3,3-ジフルオロアリルオキシ基、または3,3-ジクロロアリルオキシ基であり、さらに好ましくは、2-フルオロビニルオキシ基、または2,2-ジフルオロビニルオキシ基である。

[0156] 式(1)のR₃における「置換基Cで適宜置換されてもよいC₃～C₆のアルキニルオキシ基」のC₃～C₆のアルキニルオキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、プロパルギルオキシ基、2-ブチニルオキシ基、または3-ブチニルオキシ基であり、さらに好ましくは、プロパルギルオキシ基である。置換基Cを有する場合、C₃～C₆のアルキニルオキシ基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0157] 式(1)のR₃における「C₃～C₆のハロアルキニルオキシ基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、4,4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、4-クロロ-4,4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、4-ブromo-4,4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、または4,4,4-トリフルオロ-2-ブチニルオキシ基であり、さらに好ましくは、4,4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、または4,4,4-トリフルオロ-2-ブチニルオキシ基である。

- [0158] 式(1)のR³における「置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基」のアリール基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、フェニル基である。置換基Dを有する場合、アリール基における水素が、置換基Dによって任意に置換される。
- [0159] 式(1)のR³における「置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基」のヘテロアリール基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ピリジル基、ピラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、フリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基、またはテトラゾリル基であり、さらに好ましくは、ピリジル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、トリアゾリル基、またはテトラゾリル基である。置換基Dを有する場合、ヘテロアリール基における水素が、置換基Dによって任意に置換される。
- [0160] 式(1)のR³における「置換基Dで適宜置換されてもよいアリールオキシ基」のアリールオキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、フェノキシ基、またはナフチルオキシ基であり、さらに好ましくは、フェノキシ基である。置換基Dを有する場合、アリールオキシ基における水素原子が、置換基Dによって任意に置換される。
- [0161] 式(1)のR³における「置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリールオキシ基」のヘテロアリールオキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ピリジルオキシ基、ピリダジニルオキシ基、ピリミジニルオキシ基、ピラジニルオキシ基、ピラゾリルオキシ基、トリアジニルオキシ基、テトラジニルオキシ基、チエニルオキシ基、チアゾリルオキシ基、イソチアゾリルオキシ基、またはチアジアゾリルオキシ基であり、さらに好ましくは、ピリジルオキシ基、ピリダジニルオキシ基、ピリミジニルオキシ基、ピラジニルオキシ基、またはピラゾリルオキシ基である。置換基Dを有する場合、ヘテロアリールオキシ基における水素原子が、置換基Dによって任意に置換される。
- [0162] 式(1)のR³における「置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキルオ

キシ基」のアラルキルオキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基、またはフェニルプロピルオキシ基であり、さらに好ましくは、ベンジルオキシ基、またはフェネチルオキシ基である。置換基Dを有する場合、アラルキルオキシ基における水素原子が、置換基Dによって任意に置換される。

[0163] 式(1)のR³における「R^aR^bN-」のR^aおよびR^bは、前記と同義である。R^aおよびR^bとして、好ましくは、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基、C¹～C⁶のハロアルキル基、C³～C⁸のシクロアルキル基、ピロリジニル基、またはピペリジニル基であり、さらに好ましくは、水素原子、または置換基Bで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基である。「R^aR^bN-」として好ましくは、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、(メトキシメチル)アミノ基、(2-メトキシエチル)アミノ基、(シアノメチル)アミノ基、(2-シアノエチル)アミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、(メトキシメチル)メチルアミノ基、(2-メトキシエチル)メチルアミノ基、(シアノメチル)メチルアミノ基、(2-シアノエチル)メチルアミノ基、2, 2-ジフルオロエチルアミノ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ基、シクロプロピルアミノ基、(シクロプロピル)メチルアミノ基、ピロリジニル基、またはピペリジニル基であり、さらに好ましくは、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、またはジエチルアミノ基であり、特に好ましくは、アミノ基、メチルアミノ基、またはジメチルアミノ基である。

[0164] 式(1)のR³における「R^c-L-」のR^cおよびLは、前記と同義である。「R^c-L-」として、好ましくは、メチルチオ基、メタンスルフィニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメチルチオ基、トリフルオロメタンスルフィニル基、またはトリフルオロメタンスルホニル基であり、さらに好ましくは、メチルチオ基、メタンスルフィニル基、またはメタンスルホニル基である。

[0165] 式(1)のR³における「R^x1C(=O)―」のR^x1は、前記の定義と同義である。R^x1として、好ましくは、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルキル基、C₁～C₆のハロアルキル基、またはC₁～C₆のアルコキシ基であり、さらに好ましくは、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルキル基、またはC₁～C₆のアルコキシ基であり、特に好ましくは、水素原子である。「R^x1C(=O)―」として、好ましくは、ホルミル基、アセチル基、メトキシアセチル基、シアノアセチル基、プロピオニル基、ジフルオロアセチル基、トリフルオロアセチル基、シクロプロパンカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、2, 2-ジフルオロエトキシカルボニル基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル基、3, 3, 3-トリフルオロプロピルオキシカルボニル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、アミノカルボニル基、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニル基、(メトキシメチル)アミノカルボニル基、(2-メトキシエチル)アミノカルボニル基、(シアノメチル)アミノカルボニル基、(2-シアノエチル)アミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、エチルメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、(メトキシメチル)メチルアミノカルボニル基、(2-メトキシエチル)メチルアミノカルボニル基、(シアノメチル)メチルアミノカルボニル基、(2-シアノエチル)メチルアミノカルボニル基、2, 2-ジフルオロエチルアミノカルボニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノカルボニル基、シクロプロピルアミノカルボニル基、(シクロプロピル)メチルアミノカルボニル基、ピロリジニルカルボニル基、またはピペリジニルカルボニル基であり、さらに好ましくは、ホルミル基、アセチル基、メトキシアセチル基、シアノアセチル基、プロピオニル基、ジフルオロアセチル基、トリフルオロアセチル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基であり、特に好ましくは、ホルミル基、またはエトキシカルボニル基である。

[0166] 式(1)のR³における「R^x1C(=O)O―」のR^x1は、前記の定

義と同義である。「 $R \times 1 C (=O) O-$ 」として、好ましくは、ホルミルオキシ基、アセチルオキシ基、メトキシアセチルオキシ基、シアノアセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、ジフルオロアセチルオキシ基、トリフルオロアセチルオキシ基、シクロプロパンカルボニルオキシ基、メトキシカルボニルオキシ基、エトキシカルボニルオキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシカルボニルオキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニルオキシ基、3, 3, 3-トリフルオロプロピルオキシカルボニルオキシ基、シクロプロピルオキシカルボニルオキシ基、アミノカルボニルオキシ基、メチルアミノカルボニルオキシ基、エチルアミノカルボニルオキシ基、(メトキシメチル)アミノカルボニルオキシ基、(2-メトキシエチル)アミノカルボニルオキシ基、(シアノメチル)アミノカルボニルオキシ基、(2-シアノエチル)アミノカルボニルオキシ基、ジメチルアミノカルボニルオキシ基、エチルメチルアミノカルボニルオキシ基、ジエチルアミノカルボニルオキシ基、(メトキシメチル)メチルアミノカルボニルオキシ基、(2-メトキシエチル)メチルアミノカルボニルオキシ基、(シアノメチル)メチルアミノカルボニルオキシ基、(2-シアノエチル)メチルアミノカルボニルオキシ基、2, 2-ジフルオロエチルアミノカルボニルオキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノカルボニルオキシ基、シクロプロピルアミノカルボニルオキシ基、(シクロプロピル)メチルアミノカルボニルオキシ基、ピロリジニルカルボニルオキシ基、またはピペリジニルカルボニルオキシ基であり、さらに好ましくは、ホルミルオキシ基、アセチルオキシ基、またはトリフルオロアセチルオキシ基である。

[0167] 式(1)の R_3 における「 $R \times 2 C (=O) N (R \times 3) -$ 」(ここで、 $R \times 2$ は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ のハロアルキル基、 $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ のアルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ のハロアルコキシ基、 $C_3 \sim C_8$ のシクロアルコキシ基、または $R^a R^b N-$ (ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。))を表し、 $R \times 3$ は、水素原子、置換基Bで適宜置換されても

よいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、またはC 3～C 8のシクロアルキル基を表す。)の各用語は、前記の定義と同義である。

なお、「置換基Bで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基」に関しては、置換基Bを有する場合、C 1～C 6のアルキル基における水素原子が、置換基Bによって任意に置換される。R x 2として、好ましくは、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、C 1～C 6のアルコキシ基、またはR a R b N- (ここで、R a およびR b は、前記と同義である。)であり、さらに好ましくは、置換基Bで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基である。R x 3として、好ましくは、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、またはC 1～C 6のハロアルキル基であり、さらに好ましくは、水素原子である。R x 2の具体例として、好ましくは、水素原子、メチル基、メトキシメチル基、シアノメチル基、エチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、シクロプロピル基、メトキシ基、エトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、シクロプロピルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、(メトキシメチル)アミノ基、(2-メトキシエチル)アミノ基、(シアノメチル)アミノ基、(2-シアノエチル)アミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、(メトキシメチル)メチルアミノ基、(2-メトキシエチル)メチルアミノ基、(シアノメチル)メチルアミノ基、(2-シアノエチル)メチルアミノ基、2, 2-ジフルオロエチルアミノ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ基、シクロプロピルアミノ基、(シクロプロピル)メチルアミノ基、ピロリジニル基、またはピペリジニル基であり、さらに好ましくは、水素原子、メチル基、メトキシメチル基、シアノメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基、エトキシ基、アミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、またはジエチルアミノ基であり、特に好ましくは、メチル基である。また、R x 3の具体例として、好ましくは、水素原子、メチル基、メトキシメチル基、エトキ

シメチル基、シアノメチル基、エチル基、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基、2-シアノエチル基、プロピル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、またはシクロプロピル基であり、さらに好ましくは、水素原子、メチル基、メトキシメチル基、シアノメチル基、エチル基、2-メトキシエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、または2, 2, 2-トリフルオロエチル基であり、特に好ましくは、水素原子である。また、「 $R \times 2 C(=O)N(R \times 3)-$ 」として好ましくは、アセチルアミド基、2, 2, 2-トリフルオロアセチルアミド基、メチルカルバメート基、またはエチルカルバメート基であり、さらに好ましくは、アセチルアミド基である。

[0168] 式(1)の R^3 における「 $R \times 4 R \times 5 C=N-O-$ 」(ここで、 $R \times 4$ および $R \times 5$ は、それぞれ独立していて、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ のハロアルキル基、 $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ のアルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ のハロアルコキシ基、 $C_3 \sim C_8$ のシクロアルコキシ基、または $R^a R^b N-$ (ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。)を表す。)の各用語は前記の定義と同義である。なお、「置換基Bで適宜置換されてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基」に関しては、置換基Bを有する場合、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基における水素原子が、置換基Bによって任意に置換される。

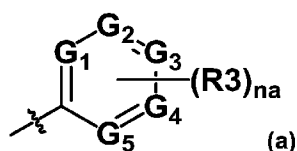
$R \times 4$ および $R \times 5$ として、好ましくは、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、メトキシ基、エトキシ基、イソプロピルオキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロブチルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、(メトキシメチル)アミノ基、(2-メトキシエチル)アミノ基、(シアノメチル)アミノ基、(2-シアノエチル)アミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチル

アミノ基、ジエチルアミノ基、（メトキシメチル）メチルアミノ基、（２－メトキシエチル）メチルアミノ基、（シアノメチル）メチルアミノ基、（２－シアノエチル）メチルアミノ基、２，２－ジフルオロエチルアミノ基、２，２，２－トリフルオロエチルアミノ基、シクロプロピルアミノ基、（シクロプロピル）メチルアミノ基、ピロリジニル基、またはピペリジニル基であり、さらに好ましくは、メチル基、エチル基、トリフルオロメチル基、２，２，２－トリフルオロエチル基、メトキシ基、エトキシ基、２，２，２－トリフルオロエトキシ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、またはジエチルアミノ基である。

[0169] 式（１）の R_3 における「１～２個の酸素原子を含む３～６員環の基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、オキサニル基、オキサニル基、１，３－ジオキサニル基、または１，３－ジオキサニル基であり、さらに好ましくは、１，３－ジオキサニル基、または１，３－ジオキサニル基である。

[0170] 以下、式（１）における Het について詳細に説明する。

[0171] A) Het が、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、またはテトラジニル基のとき、 Het は、式（a）[化12]



で表される部分構造（ここで、 R_3 は前記と同義であり、 n_a は 0～4 の整数を表す。）を表す。

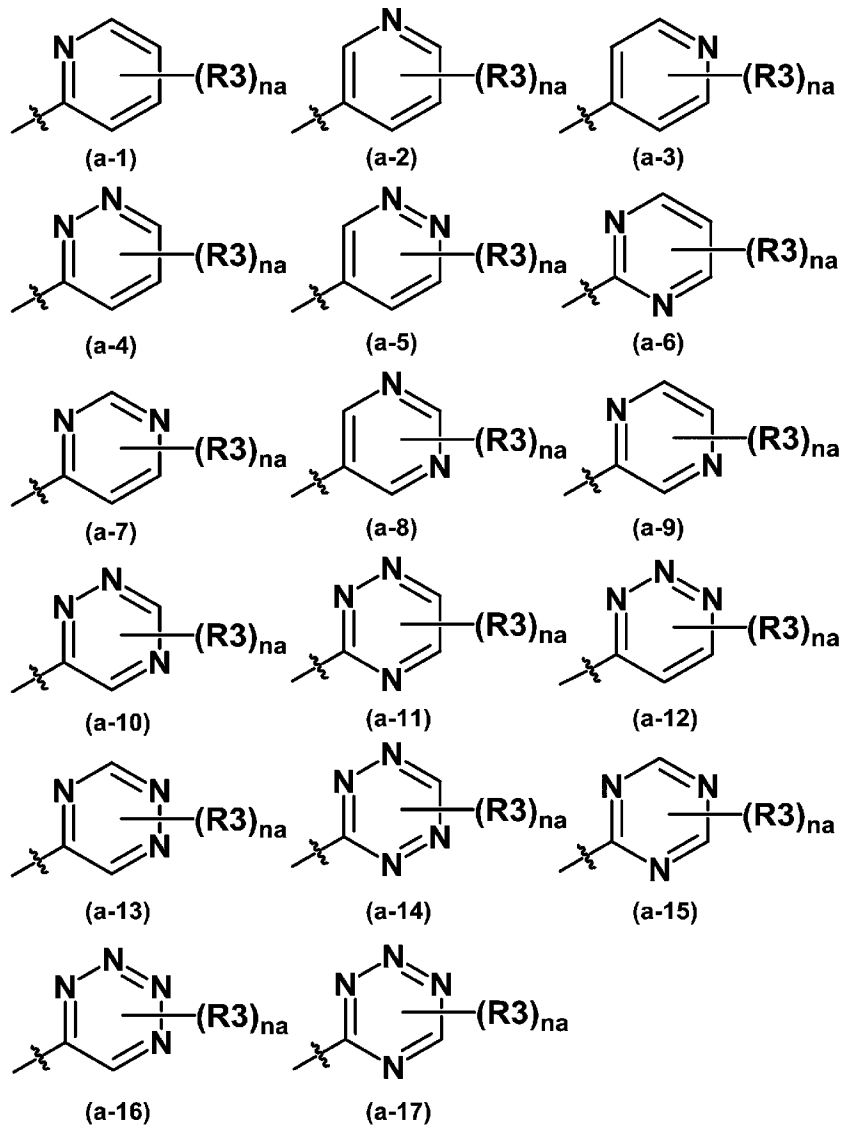
[0172] 式（a）の G_1 、 G_2 、 G_3 、 G_4 、および G_5 は、それぞれ独立していて、炭素原子または窒素原子を表す。ただし、 G_1 、 G_2 、 G_3 、 G_4 、および G_5 のうち、少なくとも一つは窒素原子である。好ましい G_1 、 G_2 、 G_3 、 G_4 、および G_5 は、 G_1 、 G_2 、 G_3 、 G_4 、および G_5 のうち、いずれか一つが窒素原子である。すなわち、ピリジル基である。

[0173] 式 (a) の n_a は、0～4 の整数を表す。

[0174] 式 (a) の n_a が 2 以上の場合、2 以上の R_3 は、それぞれ独立した置換基を表し、同一、または異なっていてよく、任意に選択することができる。

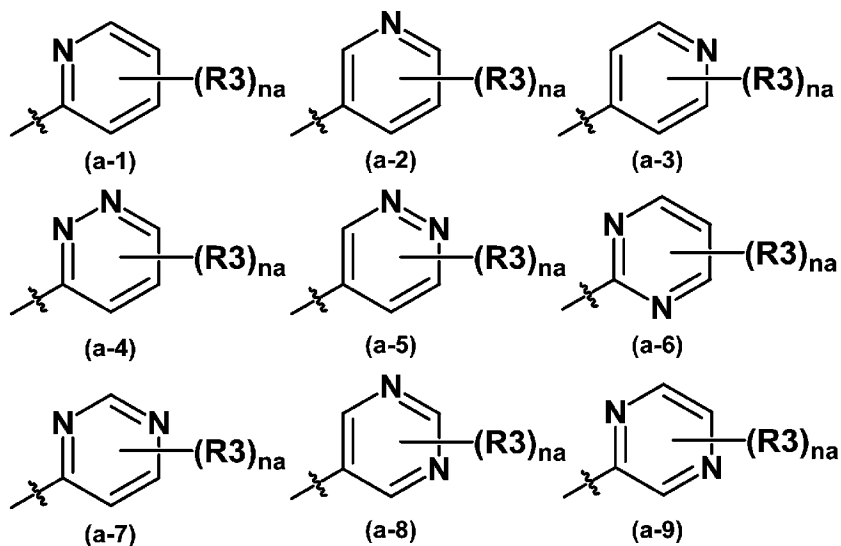
[0175] 式 (a) の部分構造の具体例を以下に示す。

[化13]



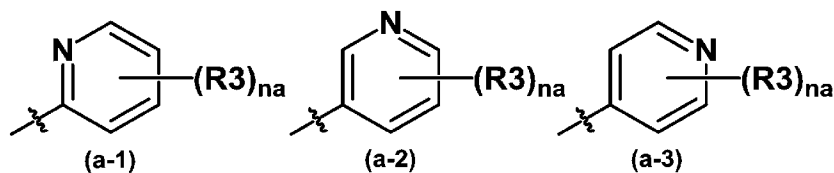
[0176] 式 (a) の部分構造のうち、好ましい具体例を以下に示す。

[化14]



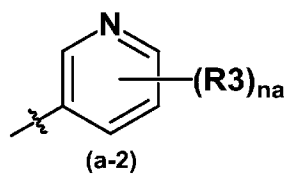
[0177] 式 (a) の部分構造のうち、さらに好ましい具体例を以下に示す。

[化15]



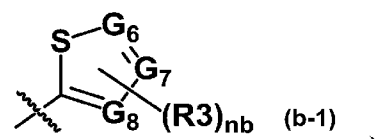
[0178] 式 (a) の部分構造のうち、特に好ましい具体例を以下に示す。

[化16]



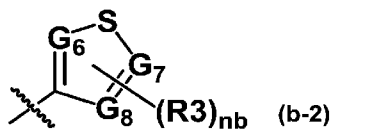
[0179] B) Het が、チエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、またはチアトリアゾリル基のとき、Het は、式 (b-1)

[化17]



または式 (b-2)

[化18]



で表される部分構造（ここで、 $R3$ は前記と同義であり、 nb は0～3の整数を表す。）を表す。

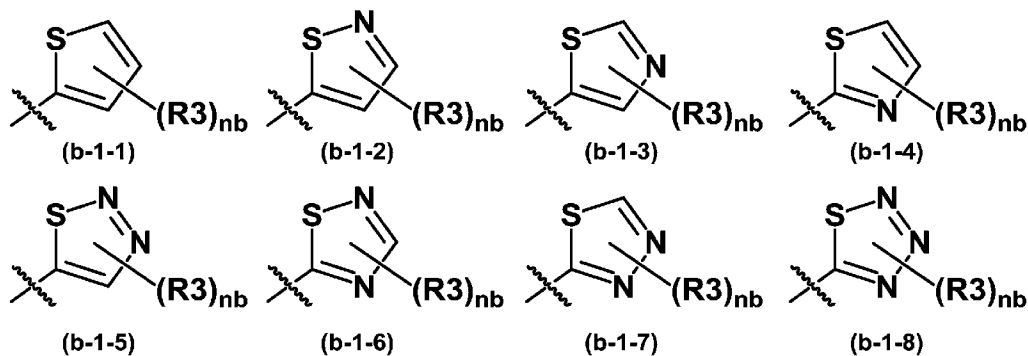
[0180] 式（b-1）、および式（b-2）における $G6$ 、 $G7$ 、および $G8$ は、それぞれ独立して、炭素原子または窒素原子を表す。

[0181] 式（b-1）、および式（b-2）の nb は、0～3の整数を表す。

[0182] 式（b-1）、および式（b-2）の nb が2以上の場合、2以上の $R3$ は、それぞれ独立した置換基を表し、同一または異なっていてよく、任意に選択することができる。

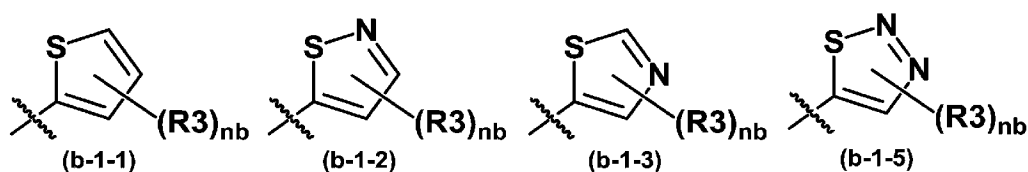
[0183] 式（b-1）の部分構造の具体例を以下に示す。

[化19]



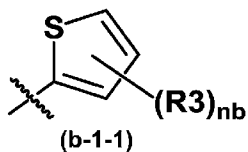
[0184] 式（b-1）の部分構造のうち、好ましい具体例を以下に示す。

[化20]



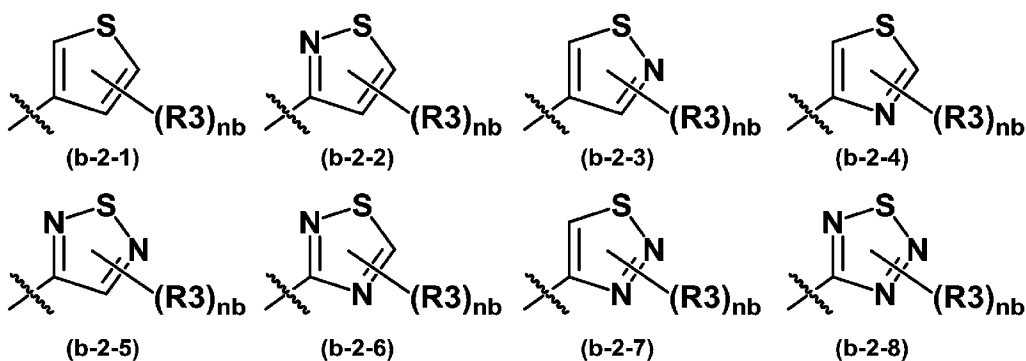
[0185] 式（b-1）の部分構造のうち、さらに好ましい具体例を以下に示す。

[化21]



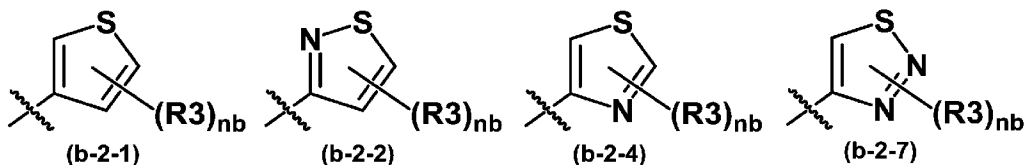
[0186] 式 (b-2) の部分構造の具体例を以下に示す。

[化22]



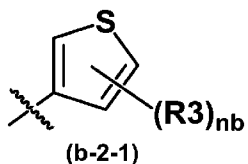
[0187] 式 (b-2) の部分構造のうち、好ましい具体例を以下に示す。

[化23]



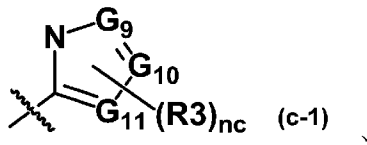
[0188] 式 (b-2) の部分構造のうち、さらに好ましい具体例を以下に示す。

[化24]



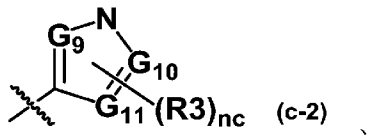
[0189] C) H e t が、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、またはペンタゾリル基のとき、H e t は、
式 (c-1)

[化25]



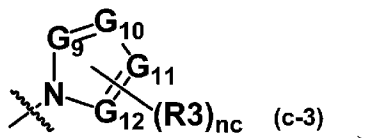
式 (c-2)

[化26]



または式 (c-3)

[化27]



で表される部分構造（ここで、R 3は前記と同義であり、n cは0～4の整数を表す。）を表す。

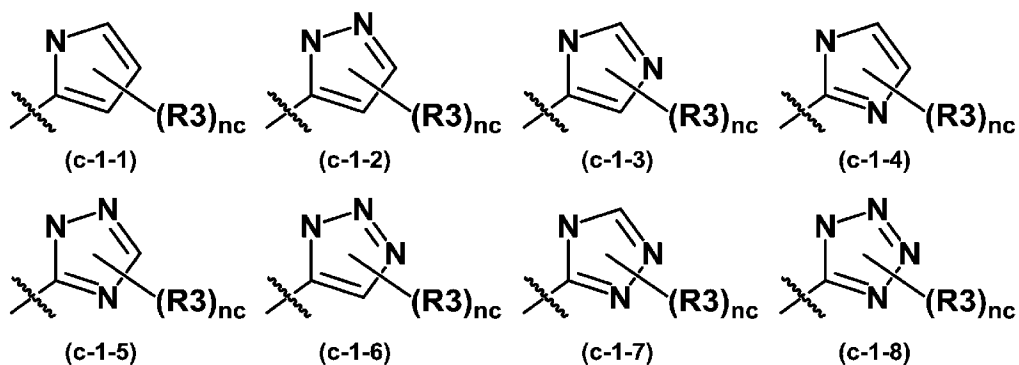
[0190] 式 (c-1)、式 (c-2)、および式 (c-3) における G 9、G 1 0、G 1 1 および G 1 2 は、それぞれ独立して、炭素原子または窒素原子を表す。

[0191] 式 (c-1)、式 (c-2)、および式 (c-3) の n c は、0～4の整数を表す。

[0192] 式 (c-1)、式 (c-2)、および式 (c-3) の n c が2以上の場合、2以上の R 3 は、それぞれ独立した置換基を表し、同一または異なっていてよく、任意に選択することができる。

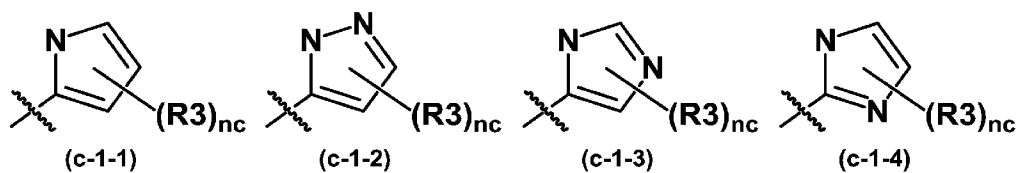
[0193] 式 (c-1) の部分構造の具体例を以下に示す。

[化28]



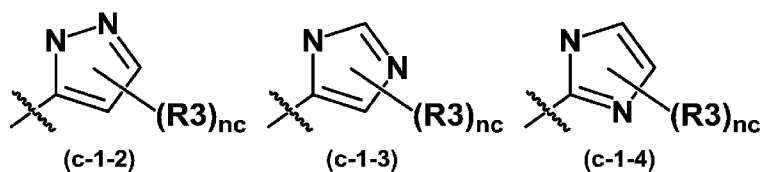
[0194] 式(c-1)の部分構造のうち、好ましい具体例を以下に示す。

[化29]



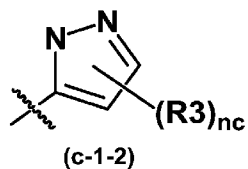
[0195] 式(c-1)の部分構造のうち、さらに好ましい具体例を以下に示す。

[化30]



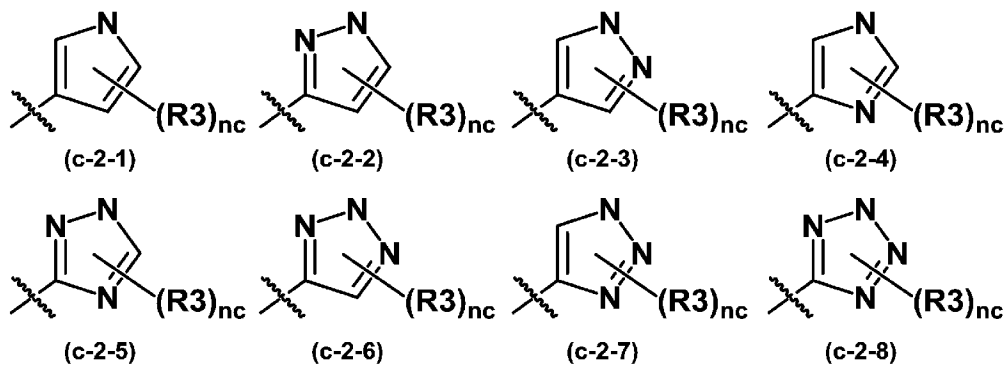
[0196] 式(c-1)の部分構造のうち、特に好ましい具体例を以下に示す。

[化31]



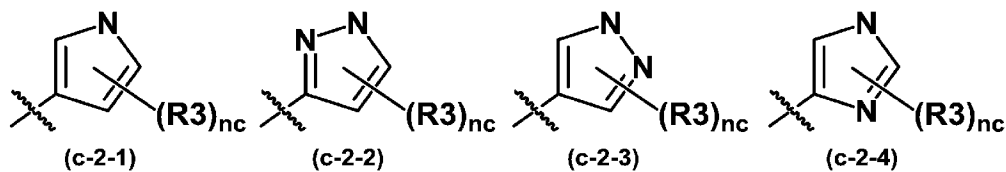
[0197] 式(c-2)の部分構造の具体例を以下に示す。

[化32]



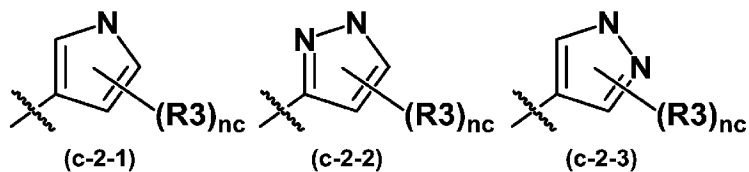
[0198] 式(c-2)の部分構造のうち、好ましい具体例を以下に示す。

[化33]



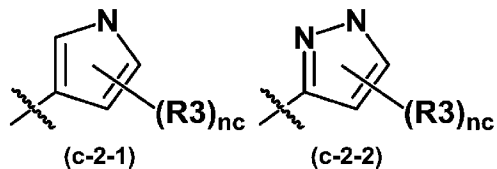
[0199] 式(c-2)の部分構造のうち、さらに好ましい具体例を以下に示す。

[化34]



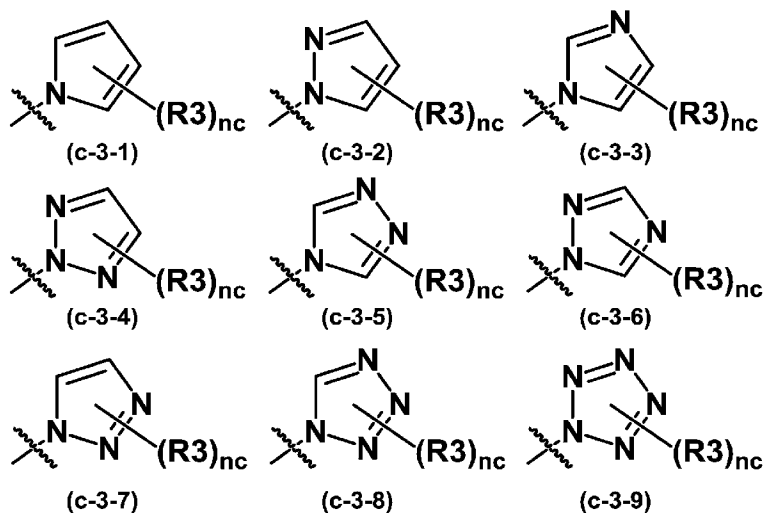
[0200] 式(c-2)の部分構造のうち、特に好ましい具体例を以下に示す。

[化35]



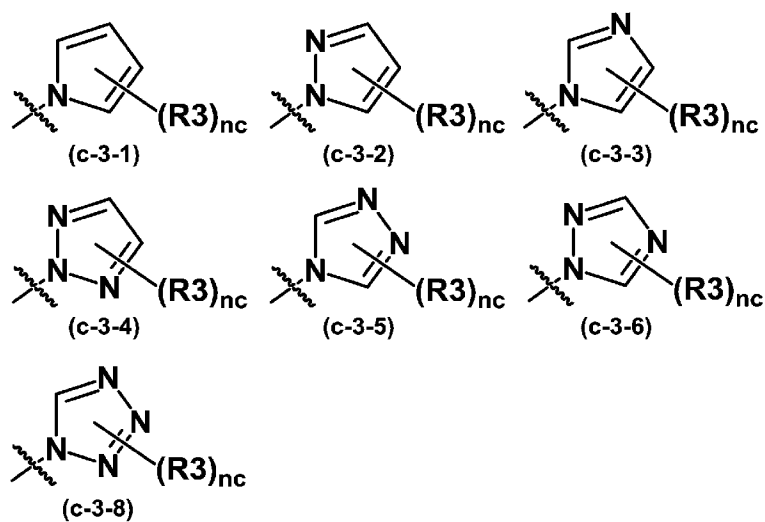
[0201] 式(c-3)の部分構造の具体例を以下に示す。

[化36]



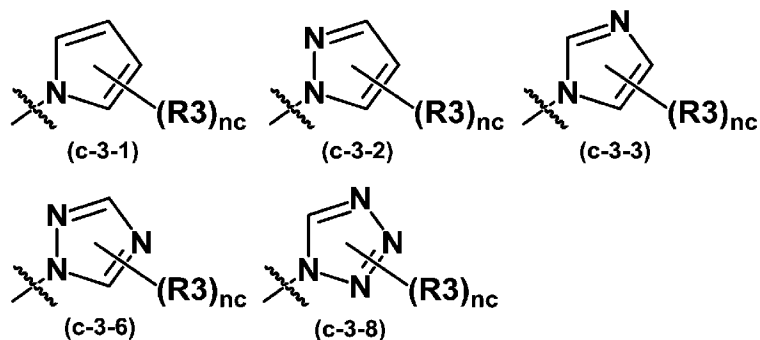
[0202] 式(c-3)の部分構造のうち、好ましい具体例を以下に示す。

[化37]



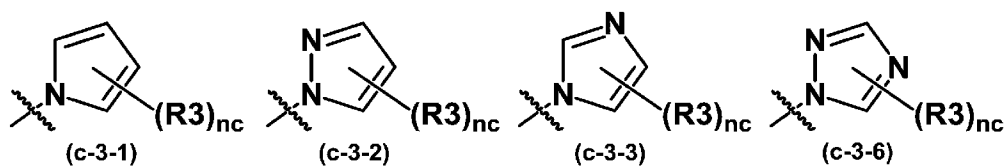
[0203] 式(c-3)の部分構造のうち、さらに好ましい具体例を以下に示す。

[化38]



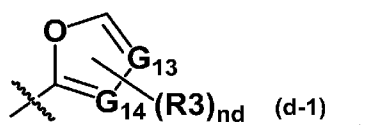
[0204] 式 (c-3) の部分構造のうち、特に好ましい具体例を以下に示す。

[化39]



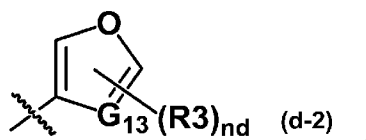
[0205] D) Het が、フリル基、またはオキサゾリル基のとき、Het は、式 (d-1)

[化40]



または式 (d-2)

[化41]



で表される部分構造（ここで、 $R3$ は前記と同義であり、 nd は 0～3 の整数を表す。）を表す。

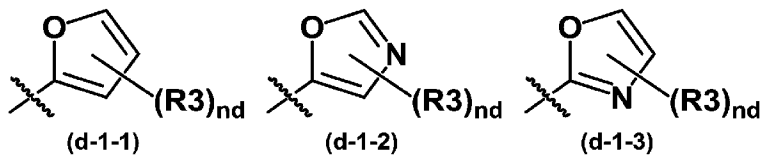
[0206] 式 (d-1)、および式 (d-2) における G_{13} 、および G_{14} は、それぞれ独立していて、炭素原子または窒素原子を表す。

[0207] 式 (d-1)、および式 (d-2) の nd は、0～3 の整数を表す。

[0208] 式 (d-1)、および式 (d-2) の nd が 2 以上の場合、2 以上の $R3$ は、それぞれ独立した置換基を表し、同一または異なっていてよく、任意に選択することができる。

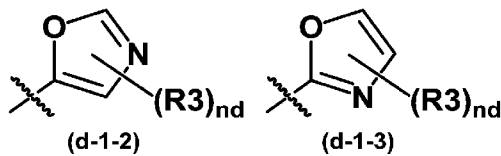
[0209] 式 (d-1) の部分構造の具体例を以下に示す。

[化42]



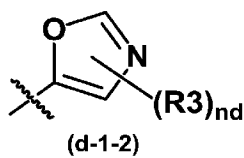
[0210] 式 (d-1) の部分構造のうち、好ましい具体例を以下に示す。

[化43]



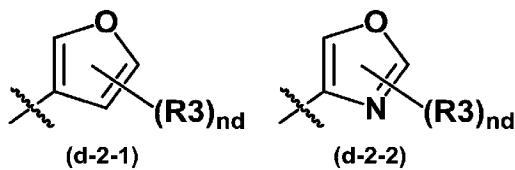
[0211] 式 (d-1) の部分構造のうち、さらに好ましい具体例を以下に示す。

[化44]



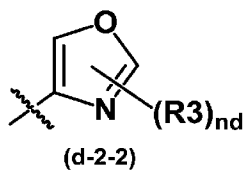
[0212] 式 (d-2) の部分構造の具体例を以下に示す。

[化45]



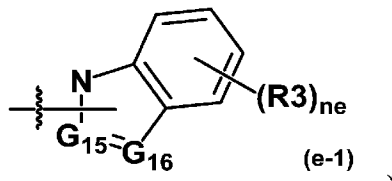
[0213] 式 (d-2) の部分構造のうち、好ましい具体例を以下に示す。

[化46]



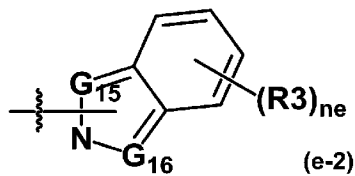
[0214] E) Het が、インドリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、ベンゾイミダゾリル基、またはベンゾトリアゾリル基のとき、Het は、式 (e-1)

[化47]



または式 (e-2)

[化48]



で表される部分構造（ここで、R 3は前記と同義であり、n eは0～6の整数を表す。）を表す。

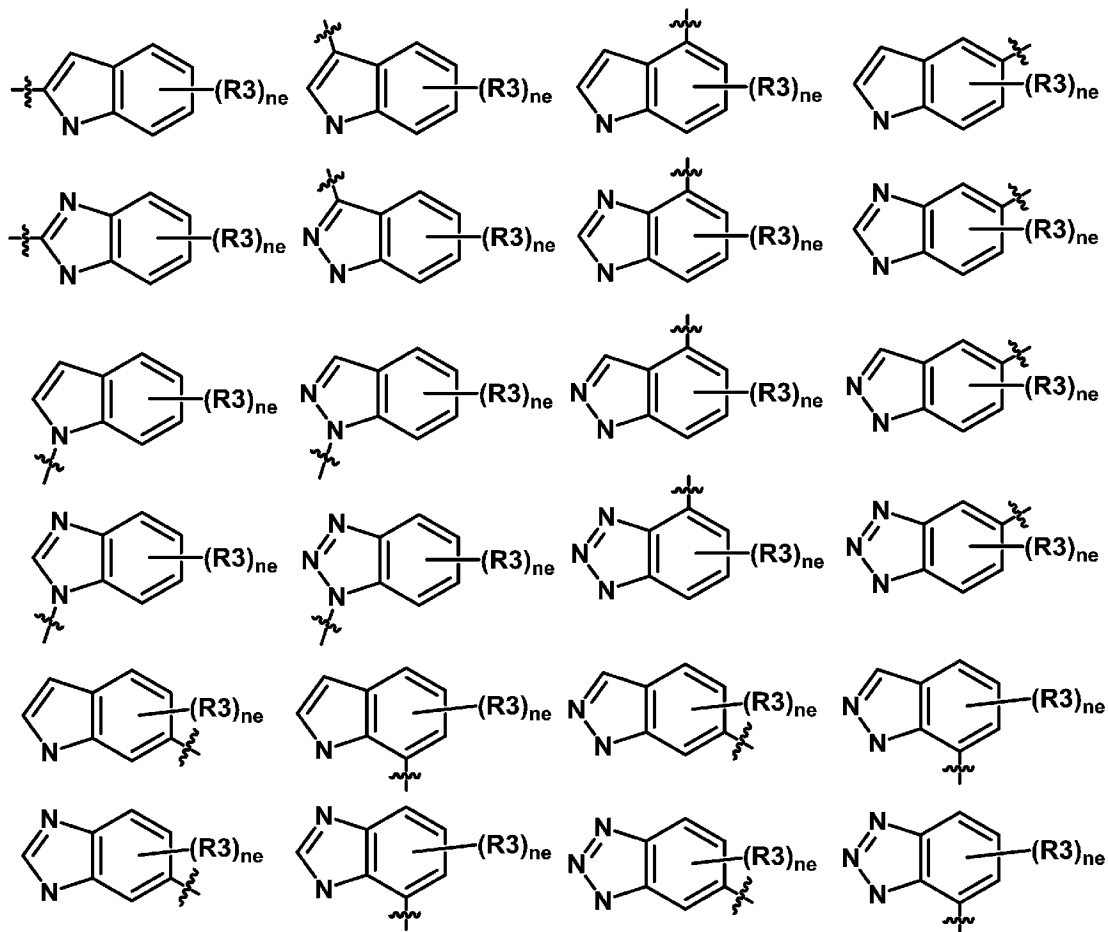
[0215] 式 (e-1)、および式 (e-2) におけるG 15、およびG 16は、それぞれ独立していて、炭素原子または窒素原子を表す。

[0216] 式 (e-1)、および式 (e-2) のn eは、0～6の整数を表す。

[0217] 式 (e-1)、および式 (e-2) のn eが2以上の場合、2以上のR 3は、それぞれ独立した置換基を表し、同一または異なっていてよく、任意に選択することができる。

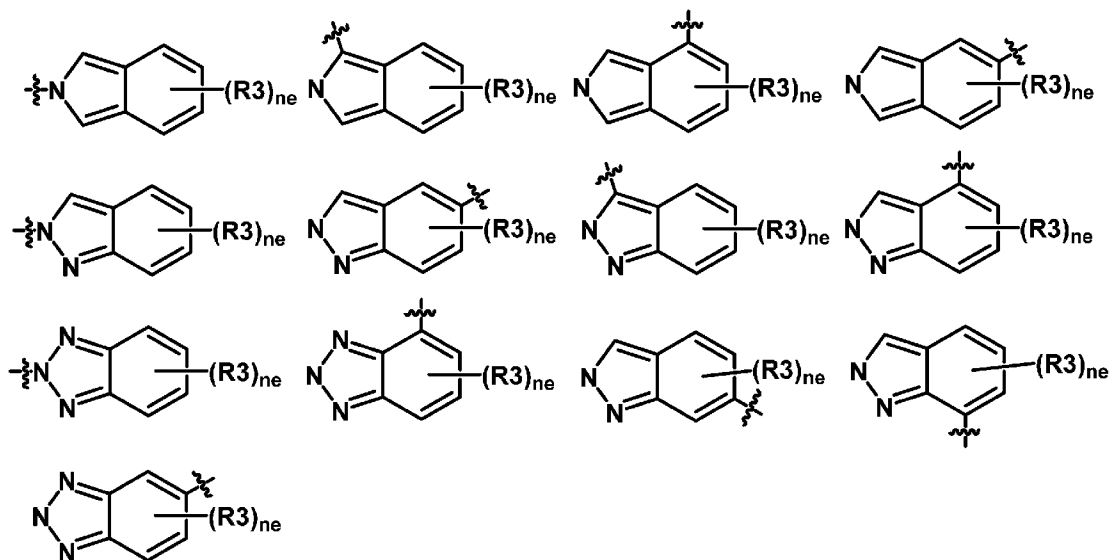
[0218] 式 (e-1) の部分構造の具体例を以下に示す。

[化49]



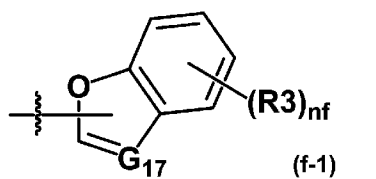
[0219] 式(e-2)の部分構造の具体例を以下に示す。

[化50]



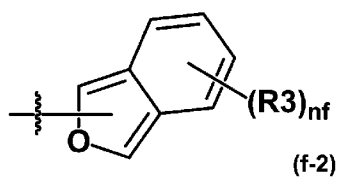
[0220] F) Het が、ベンゾフリル基、イソベンゾフリル基、またはベンゾオキサフリル基のとき、Het は、式 (f-1)

[化51]



または式 (f-2)

[化52]



で表される部分構造（ここで、R3は前記と同義であり、nfは0～5の整数を表す。）を表す。

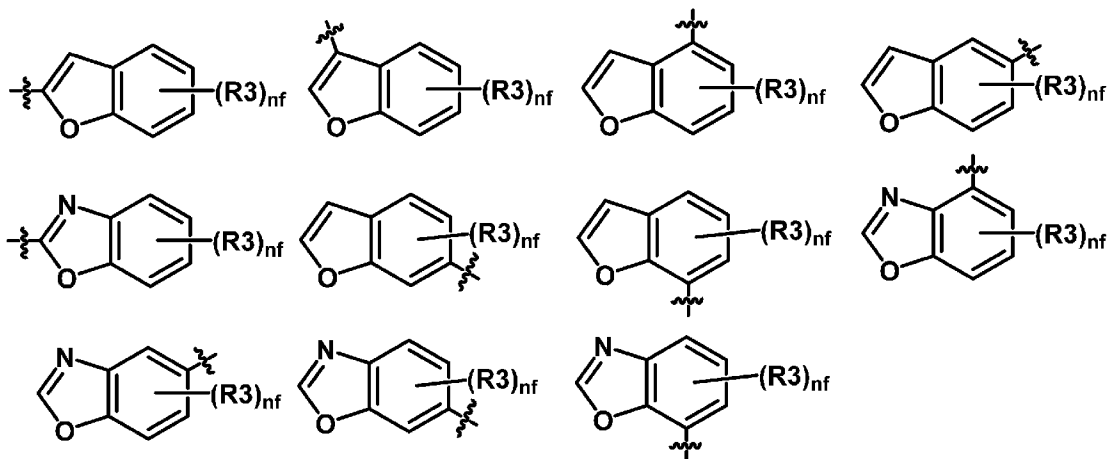
[0221] 式 (f-1) におけるG17は、炭素原子または窒素原子を表す。

[0222] 式 (f-1)、および式 (f-2) のnfは、0～5の整数を表す。

[0223] 式 (f-1)、および式 (f-2) のnfが2以上の場合、2以上のR3は、それぞれ独立した置換基を表し、同一または異なっていてよく、任意に選択することができる。

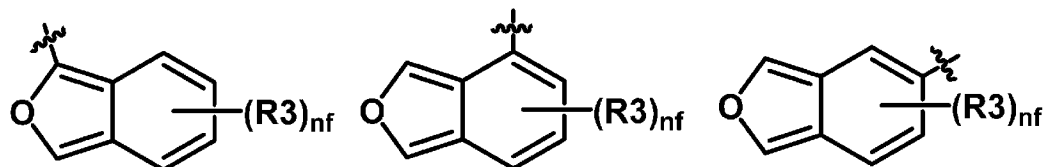
[0224] 式 (f-1) の部分構造の具体例を以下に示す。

[化53]



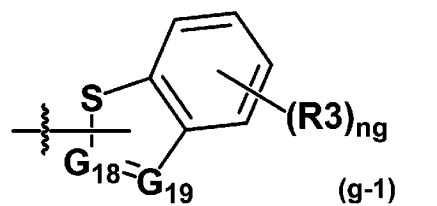
[0225] 式 (f-2) の部分構造の具体例を以下に示す。

[化54]



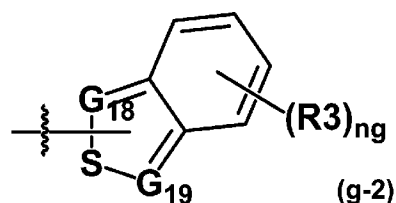
[0226] G) H e t が、ベンゾチエニル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾイソチアゾリル基、またはベンゾチアジアゾリル基のとき、H e t は、式 (g-1)

[化55]



または式 (g-2)

[化56]



で表される部分構造（ここで、R 3 は前記と同義であり、n g は 0 ～ 5 の整数を表す。）を表す。

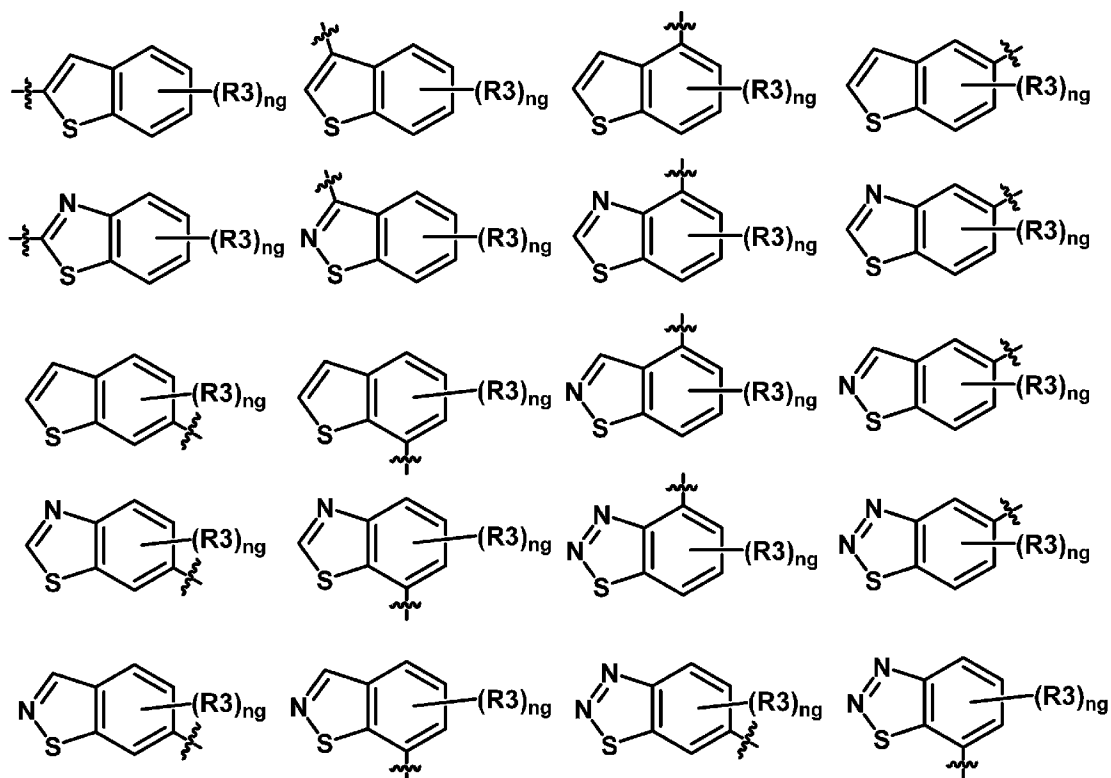
[0227] 式 (g-1)、および式 (g-2) における G 1 8、および G 1 9 は、それぞれ独立していて、炭素原子または窒素原子を表す。

[0228] 式 (g-1)、および式 (g-2) の n g は、0 ～ 5 の整数を表す。

式 (g-1)、および式 (g-2) の n g が 2 以上の場合、2 以上の R 3 は、それぞれ独立した置換基を表し、同一または異なっていてよく、任意に選択することができる。

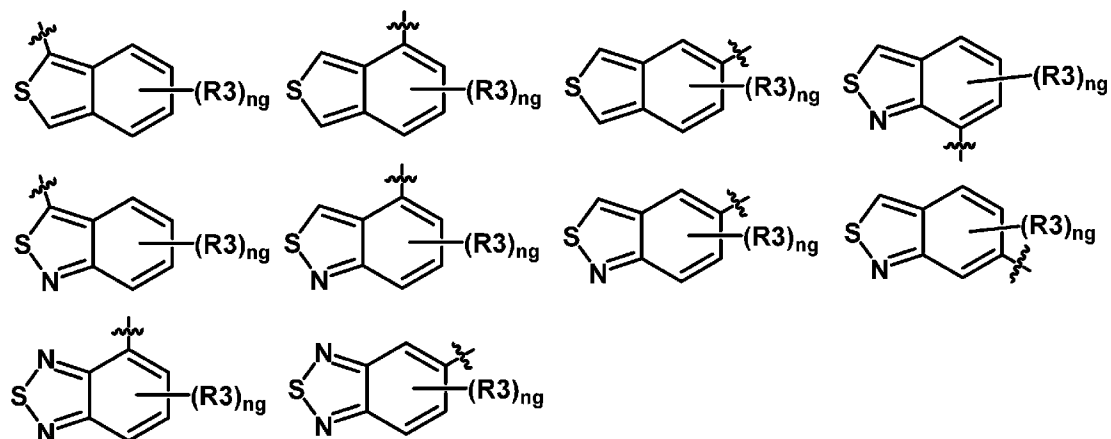
[0229] 式 (g-1) の部分構造の具体例を以下に示す。

[化57]



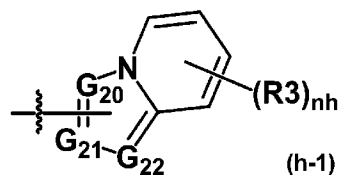
[0230] 式 (g-2) の部分構造の具体例を以下に示す。

[化58]



[0231] H) Het が、インドリジニル基、イミダゾピリジル基、ピラゾロピリジル基、またはトリアゾロピリジル基のとき、Het は、式 (h-1)

[化59]



で表される部分構造（ここで、 R_3 は前記と同義であり、 nh は0～6の整数を表す。）を表す。

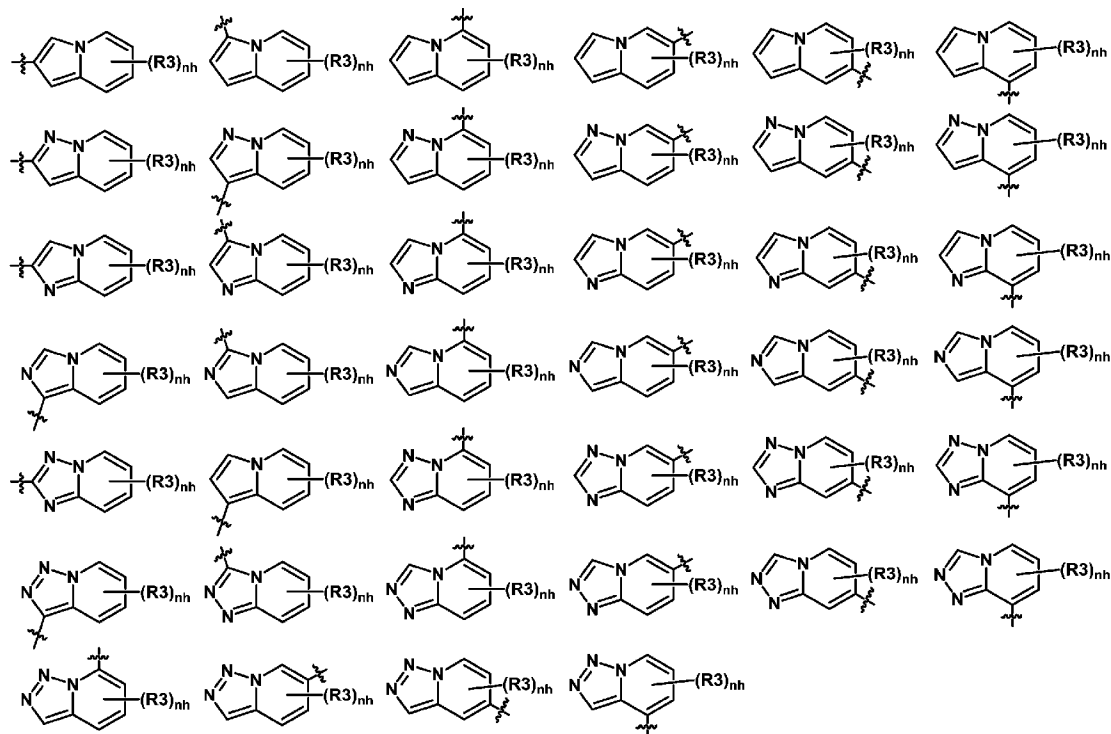
[0232] 式（ $h-1$ ）における G_{20} 、 G_{21} 、および G_{22} は、それぞれ独立して、炭素原子または窒素原子を表す。

[0233] 式（ $h-1$ ）の nh は、0～6の整数を表す。

[0234] 式（ $h-1$ ）の nh が2以上の場合、2以上の R_3 は、それぞれ独立した置換基を表し、同一または異なっていてよく、任意に選択することができる。

[0235] 式（ $h-1$ ）の部分構造の具体例を以下に示す。

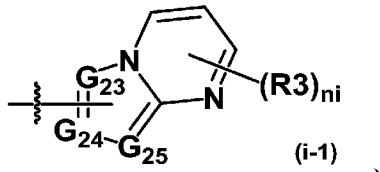
[化60]



[0236] 1) Het が、ピロロピリミジニル基、イミダゾピリミジニル基、ピラゾロピリミジニル基、トリアゾロピリミジニル基、ピロロピラジニル基、イミダ

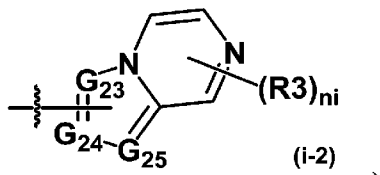
ゾピラジニル基、ピラゾロピラジニル基、またはトリアゾロピラジニル基のとき、Hetは、式(i-1)

[化61]



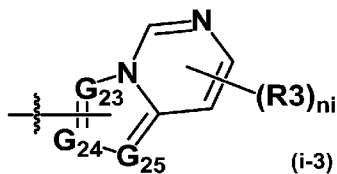
式(i-2)

[化62]



または式(i-3)

[化63]



で表される部分構造（ここで、R3は前記と同義であり、niは0～5の整数を表す。）を表す。

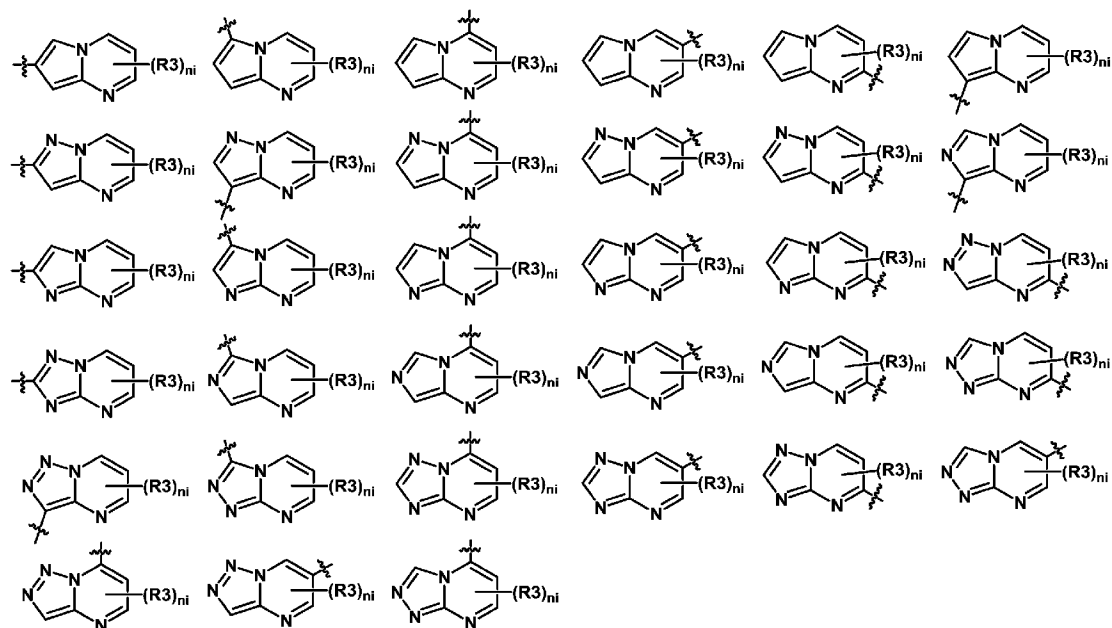
[0237] 式(i-1)、式(i-2)および式(i-3)におけるG23、G24、およびG25は、それぞれ独立して、炭素原子または窒素原子を表す。

[0238] 式(i-1)、式(i-2)および式(i-3)のniは、0～5の整数を表す。

[0239] 式(i-1)、式(i-2)および式(i-3)のniが2以上の場合、2以上のR3は、それぞれ独立した置換基を表し、同一または異なっていてよく、任意に選択することができる。

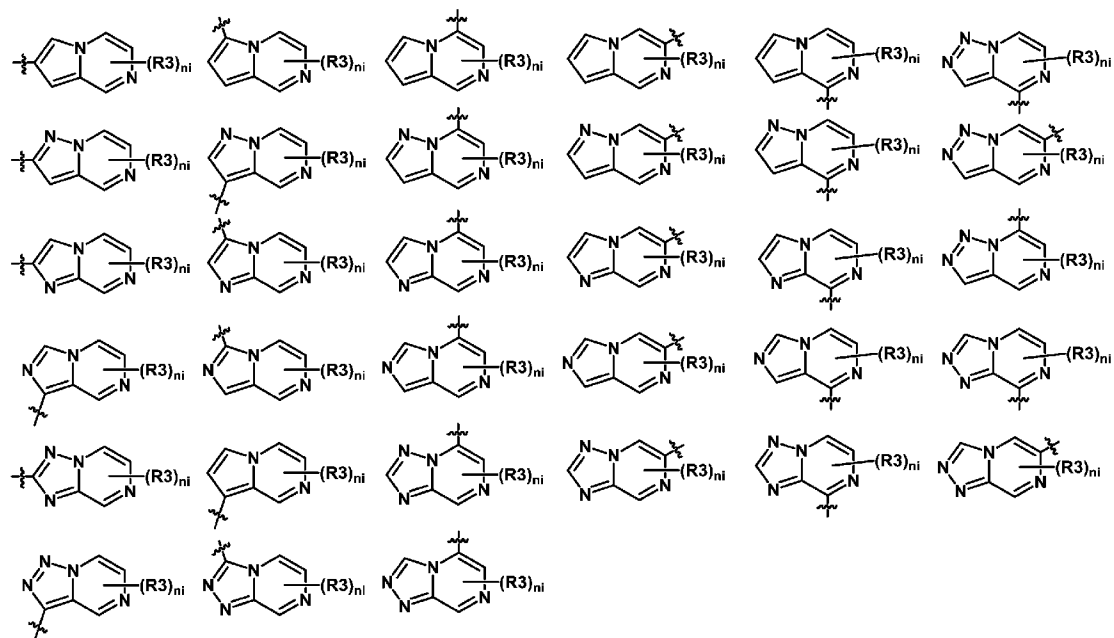
[0240] 式(i-1)の部分構造の具体例を以下に示す。

[化64]



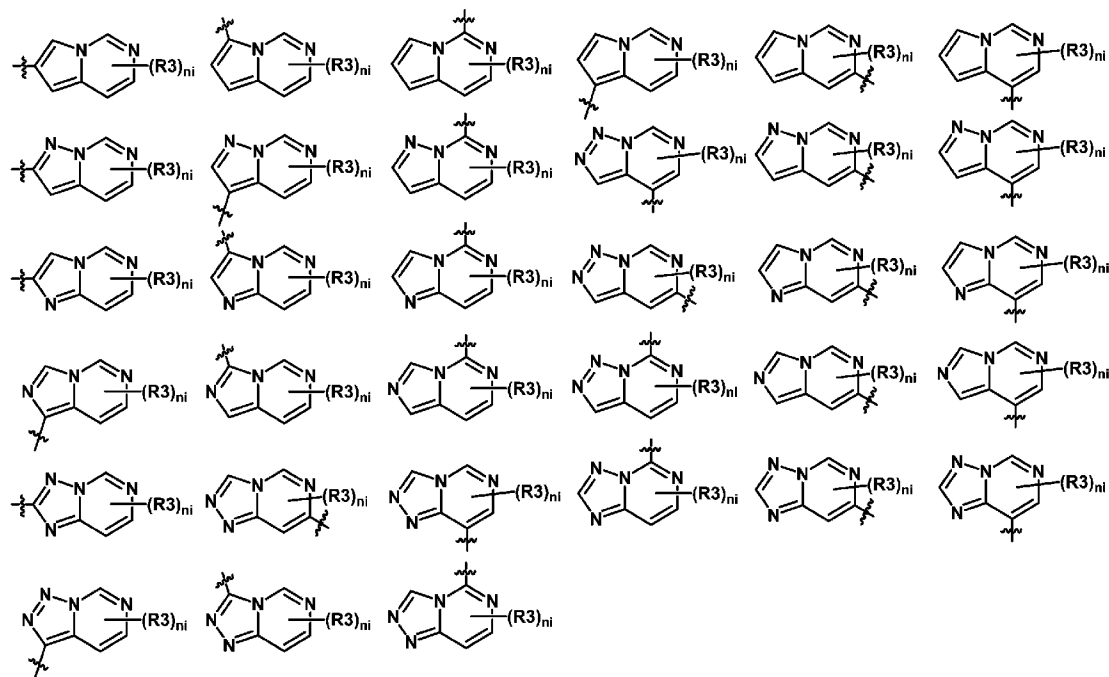
[0241] 式 (i - 2) の部分構造の具体例を以下に示す。

[化65]



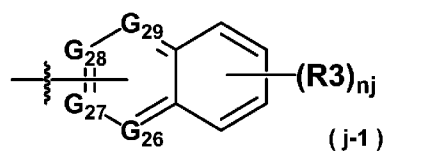
[0242] 式 (i - 3) の部分構造の具体例を以下に示す。

[化66]



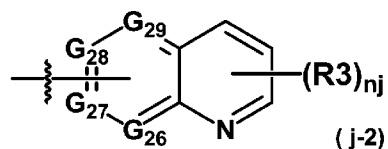
[0243] J) Het が、キノリル基、イソキノリル基、シノリル基、フタラジニル基、キノキサリニル基、キナゾリニル基、またはナフチリジニル基のとき、Het は、式 (j-1)

[化67]



または式 (j-2)

[化68]



で表される部分構造（ここで、R3は前記と同義であり、njは0～6の整数を表す。）を表す。

[0244] 式 (j-1)、および式 (j-2) におけるG26、G27、G28およびG29は、それぞれ独立して、炭素原子または窒素原子を表す。ただ

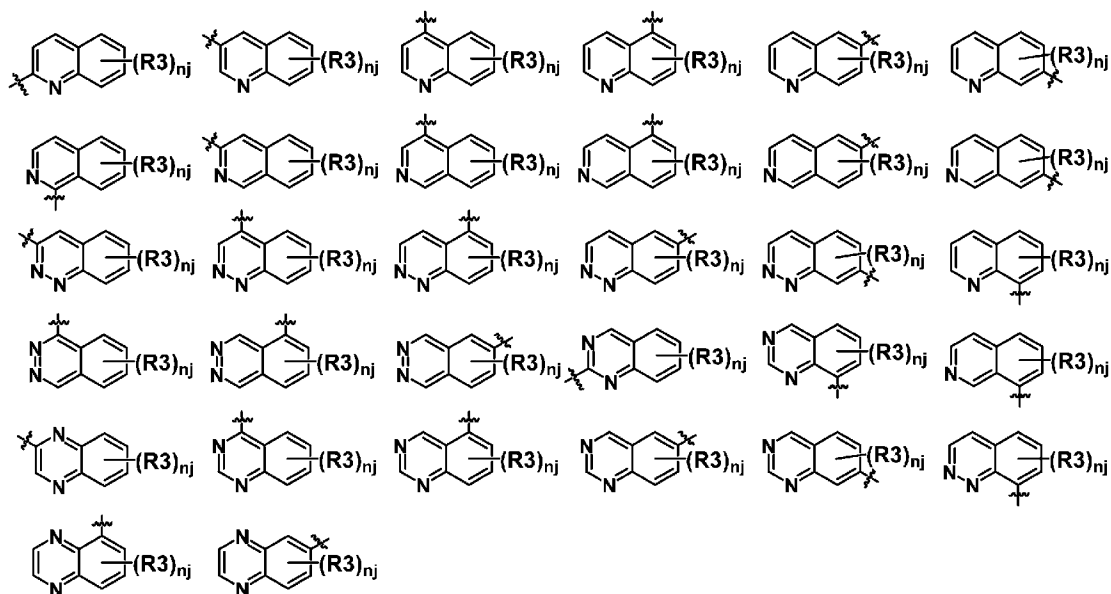
し、G 2 6、G 2 7、G 2 8およびG 2 9のうち、少なくとも一つは窒素原子である。式（j - 1）において、好ましいG 2 6、G 2 7、G 2 8およびG 2 9は、G 2 6、G 2 7、G 2 8およびG 2 9のうち、いずれか一つが窒素原子である。すなわち、キノリル基である。

[0245] 式（j - 1）、および式（j - 2）の n_j は、0～6の整数を表す。

[0246] 式（j - 1）、および式（j - 2）の n_j が2以上の場合、2以上のR 3は、それぞれ独立した置換基を表し、同一または異なっていてよく、任意に選択することができる。

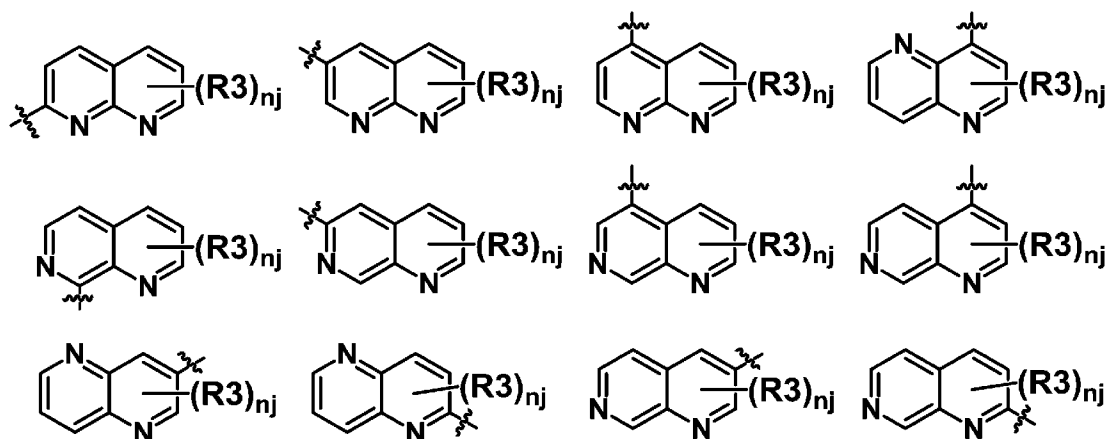
[0247] 式（j - 1）の部分構造の具体例を以下に示す。

[化69]



[0248] 式（j - 2）の部分構造の具体例を以下に示す。

[化70]



[0249] N) H e t が、「1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基」のとき、H e t は、1, 2-エポキシエタニル基、オキセタニル基、オキソラニル基、オキサニル基、1, 3-ジオキソラニル基、1, 3-ジオキサニル基、または1, 4-ジオキサニル基を表す。中でも、オキソラニル基、オキサニル基、1, 3-ジオキソラニル基、1, 3-ジオキサニル基、または1, 4-ジオキサニル基が好ましく、特に、1, 3-ジオキソラニル基、または1, 3-ジオキサニル基が好ましい。

[0250] 式(1)のYは、フェニル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、テトラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、またはチアジアゾリル基を表す。中でも、フェニル基、またはピリジル基が好ましく、特に、フェニル基が好ましい。

[0251] 該フェニル基は、R 4 がオルト位に置換し、さらにR 5 が適宜0～4置換する。(ただし、2置換以上のR 5 がある場合、R 5 はそれぞれ独立した置換基を表す。)

[0252] 該ピリジル基、該ピリダジニル基、該ピリミジニル基、該ピラジニル基、該トリアジニル基、または該テトラジニル基は、R 4 がオルト位に置換し、さらにR 5 が適宜0～3置換する。(ただし、2置換以上のR 5 がある場合、R 5 はそれぞれ独立した置換基を表す。)

[0253] 該チエニル基、該チアゾリル基、該イソチアゾリル基、または該チアジア

ゾリル基は、R₄がオルト位に置換し、さらにR₅が適宜0～2置換する。
 (ただし、2置換のR₅がある場合、R₅はそれぞれ独立した置換基を表す。)

[0254] 式(1)におけるR₄は、水酸基、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、置換基Cで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルキル基、C₁～C₆のハロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₃～C₈のシクロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルケニル基、C₂～C₆ハロアルケニル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルキニル基、C₂～C₆のハロアルキニル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、C₁～C₆のハロアルコキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₃～C₈のシクロアルコキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルケニルオキシ基、C₂～C₆のハロアルケニルオキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₃～C₆のアルキニルオキシ基、C₃～C₆のハロアルキニルオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基、置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基、置換基Dで適宜置換されてもよいアリールオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリールオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキルオキシ基、R_aR_bN- (ここで、R_aおよびR_bは、前記と同義である。)、R_c-L- (ここで、R_cおよびLは、前記と同義である。)、R_{x1}C(=O)- (ここでR_{x1}は、前記と同義である。)、R_{x1}C(=O)O- (ここでR_{x1}は、前記と同義である。)、R_{x2}C(=O)N(R_{x3})- (ここで、R_{x2}およびR_{x3}は、前記と同義である。)、R_{x4}R_{x5}C=N-O- (ここで、R_{x4}およびR_{x5}は前記と同義である。)、または1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基を表す。

[0255] 中でも、R₄は、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、置換基Cで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルキル基、C₁～C₆のハロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、またはC₁～C₆のハロアルコキシ基が好ましく、

特に、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、または置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基が好ましく、

さらに、シアノ基、ハロゲン原子、置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、または置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基が好ましい。

[0256] 式(1)のR₄には、水酸基、シアノ基、およびニトロ基が含まれる。

[0257] 式(1)のR₄におけるハロゲン原子は、前記の定義と同義であり、好ましくはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、またはヨウ素原子であり、さらに好ましくは、フッ素原子、塩素原子、または臭素原子である。

[0258] 式(1)のR₄における「置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基」のC 1～C 6のアルキル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、メチル基、エチル基、プロピル基、またはイソプロピル基であり、さらに好ましくは、メチル基、エチル基、またはプロピル基であり、特に好ましくは、メチル基、またはエチル基である。置換基Cを有する場合、C 1～C 6のアルキル基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0259] 式(1)のR₄における「C 1～C 6のハロアルキル基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、3, 3-ジフルオロプロピル基、または3, 3, 3-トリフルオロプロピル基であり、さらに好ましくは、ジフルオロメチル基、またはトリフルオロメチル基であり、特に好ましくは、トリフルオロメチル基である。

[0260] 式(1)のR₄における「置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルキル基」のC 3～C 8のシクロアルキル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、またはシクロヘキシル基であり、さらに好ましくは、シクロプロピル基、またはシクロブチル基である。置換基Cを有する場合、C 3～C 8のシク

ロアルキル基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0261] 式(1)のR₄における「置換基Cで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルケニル基」のC₂～C₆のアルケニル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ビニル基、1-プロペニル基、アリル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、または3-ブテニル基であり、さらに好ましくは、ビニル基である。置換基Cを有する場合、C₂～C₆のアルケニル基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0262] 式(1)のR₄における「C₂～C₆のハロアルケニル基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、2-フルオロビニル基、2,2-ジフルオロビニル基、2,2-ジクロロビニル基、3-フルオロアリル基、3,3-ジフルオロアリル基、または3,3-ジクロロアリル基であり、さらに好ましくは、2-フルオロビニル基、または2,2-ジフルオロビニル基である。

[0263] 式(1)のR₄における「置換基Cで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルキニル基」のC₂～C₆のアルキニル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、エチニル基、1-プロピニル基、またはプロパルギル基であり、さらに好ましくは、エチニル基である。置換基Cを有する場合、C₂～C₆のアルキニル基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0264] 式(1)のR₄における「C₂～C₆のハロアルキニル基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、3,3-ジフルオロ-1-プロピニル基、3,3,3-トリフルオロ-1-プロピニル基、4,4-ジフルオロ-1-ブチニル基、4,4,4-トリフルオロ-1-ブチニル基、または4,4,4-トリフルオロ-2-ブチニル基であり、さらに好ましくは、3,3-ジフルオロ-1-プロピニル基、または3,3,3-トリフルオロ-1-プロピニル基である。

[0265] 式(1)のR₄における「置換基Cで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルコキシ基」のC₁～C₆のアルコキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、またはイソプロ

ピルオキシ基であり、さらに好ましくは、メトキシ基、またはエトキシ基であり、特に好ましくは、メトキシ基である。置換基Cを有する場合、C 1～C 6のアルコキシ基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0266] 式(1)のR₄における「C 1～C 6のハロアルコキシ基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、3, 3-ジフルオロプロピルオキシ基、または3, 3, 3-トリフルオロプロピルオキシ基であり、さらに好ましくは、ジフルオロメトキシ基、またはトリフルオロメトキシ基である。

[0267] 式(1)のR₄における「置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルコキシ基」のC 3～C 8のシクロアルコキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、シクロプロピルオキシ基、シクロブトキシ基、シクロペンチルオキシ基、またはシクロヘキシルオキシ基であり、さらに好ましくは、シクロプロピルオキシ基、またはシクロブトキシ基である。置換基Cを有する場合、C 3～C 8のシクロアルコキシ基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0268] 式(1)のR₄における「置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニルオキシ基」のC 2～C 6のアルケニルオキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ビニルオキシ基、1-プロペニルオキシ基、またはアリルオキシ基であり、さらに好ましくは、アリルオキシ基である。置換基Cを有する場合、C 2～C 6のアルケニルオキシ基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0269] 式(1)のR₄における「C 2～C 6のハロアルケニルオキシ基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、2-フルオロビニルオキシ基、2, 2-ジフルオロビニルオキシ基、2, 2-ジクロロビニルオキシ基、3-フルオロアリルオキシ基、3, 3-ジフルオロアリルオキシ基、または3, 3-ジクロロアリルオキシ基であり、さらに好ましくは、2-フルオロビニルオ

キシ基、または2，2-ジフルオロビニルオキシ基である。

[0270] 式(1)のR₄における「置換基Cで適宜置換されてもよいC₃～C₆のアルキニルオキシ基」のC₃～C₆のアルキニルオキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、プロパルギルオキシ基、2-ブチニルオキシ基、または3-ブチニルオキシ基であり、さらに好ましくは、プロパルギルオキシ基である。置換基Cを有する場合、C₃～C₆のアルキニルオキシ基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0271] 式(1)のR₄における「C₃～C₆のハロアルキニルオキシ基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、4，4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、4-クロロ-4，4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、4-ブromo-4，4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、または4，4，4-トリフルオロ-2-ブチニルオキシ基であり、さらに好ましくは、4，4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、または4，4，4-トリフルオロ-2-ブチニルオキシ基である。

[0272] 式(1)のR₄における「置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基」のアリール基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、フェニル基である。置換基Dを有する場合、アリール基における水素が、置換基Dによって任意に置換される。

[0273] 式(1)のR₄における「置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基」のヘテロアリール基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ピリジル基、ピラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、フリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基、またはテトラゾリル基であり、さらに好ましくは、ピリジル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、トリアゾリル基、またはテトラゾリル基である。置換基Dを有する場合、ヘテロアリール基における水素が、置換基Dによって任意に置換される。

[0274] 式(1)のR₄における「置換基Dで適宜置換されてもよいアリールオキシ基」のアリールオキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、フェ

ノキシ基、またはナフチルオキシ基であり、さらに好ましくは、フェノキシ基である。置換基Dを有する場合、アリールオキシ基における水素原子が、置換基Dによって任意に置換される。

[0275] 式(1)のR₄における「置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリールオキシ基」のヘテロアリールオキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ピリジルオキシ基、ピリダジニルオキシ基、ピリミジニルオキシ基、ピラジニルオキシ基、ピラゾリルオキシ基、トリアジニルオキシ基、テトラジニルオキシ基、チエニルオキシ基、チアゾリルオキシ基、イソチアゾリルオキシ基、またはチアジアゾリルオキシ基であり、さらに好ましくは、ピリジルオキシ基、ピリダジニルオキシ基、ピリミジニルオキシ基、ピラジニルオキシ基、またはピラゾリルオキシ基である。置換基Dを有する場合、ヘテロアリールオキシ基における水素原子が、置換基Dによって任意に置換される。

[0276] 式(1)のR₄における「置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキルオキシ基」のアラルキルオキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基、またはフェニルプロピルオキシ基であり、さらに好ましくは、ベンジルオキシ基である。置換基Dを有する場合、アラルキルオキシ基における水素原子が、置換基Dによって任意に置換される。

[0277] 式(1)のR₄における「R^aR^bN-」のR^aおよびR^bは、前記と同義である。「R^aR^bN-」として好ましくは、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、(メトキシメチル)アミノ基、(2-メトキシエチル)アミノ基、(シアノメチル)アミノ基、(2-シアノエチル)アミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、(メトキシメチル)メチルアミノ基、(2-メトキシエチル)メチルアミノ基、(シアノメチル)メチルアミノ基、(2-シアノエチル)メチルアミノ基、2, 2-ジフルオロエチルアミノ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ基、シクロプロピルアミノ基、(シクロプロピル)メチルアミノ基、ピロリジニル

基、またはピペリジニル基であり、さらに好ましくは、アミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、またはジエチルアミノ基である。

[0278] 式(1)のR⁴における「R^c-L⁻」のR^cおよびL⁻は、前記と同義である。「R^c-L⁻」として、好ましくは、メチルチオ基、メタンスルフィニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメチルチオ基、トリフルオロメタンスルフィニル基、またはトリフルオロメタンスルホニル基であり、さらに好ましくは、メチルチオ基、メタンスルフィニル基、またはメタンスルホニル基である。

[0279] 式(1)のR⁴における「R^x1C(=O)-」のR^x1は、前記の定義と同義である。「R^x1C(=O)-」として、好ましくは、アセチル基、メトキシアセチル基、シアノアセチル基、プロピオニル基、ジフルオロアセチル基、トリフルオロアセチル基、シクロプロパンカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、2, 2-ジフルオロエトキシカルボニル基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル基、3, 3, 3-トリフルオロプロピルオキシカルボニル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、アミノカルボニル基、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニル基、(メトキシメチル)アミノカルボニル基、(2-メトキシエチル)アミノカルボニル基、(シアノメチル)アミノカルボニル基、(2-シアノエチル)アミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、エチルメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、(メトキシメチル)メチルアミノカルボニル基、(2-メトキシエチル)メチルアミノカルボニル基、(シアノメチル)メチルアミノカルボニル基、(2-シアノエチル)メチルアミノカルボニル基、2, 2-ジフルオロエチルアミノカルボニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノカルボニル基、シクロプロピルアミノカルボニル基、(シクロプロピル)メチルアミノカルボニル基、ピロリジニルカルボニル基、またはピペリジニルカルボニル基であり、さらに好ましくは、アセチル基、メトキシアセチル基、シアノアセチル基、ジフルオロアセチル基、トリフルオロアセチル基、メトキシカルボニル基、エトキシカル

ボニル基、アミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、エチルメチルアミノカルボニル基、またはジエチルアミノカルボニル基である。

[0280] 式(1)のR⁴における「R^x1C(=O)O⁻」のR^x1は、前記の定義と同義である。「R^x1C(=O)O⁻」として、好ましくは、アセチルオキシ基、メトキシアセチルオキシ基、シアノアセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、ジフルオロアセチルオキシ基、トリフルオロアセチルオキシ基、シクロプロパンカルボニルオキシ基、メトキシカルボニルオキシ基、エトキシカルボニルオキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシカルボニルオキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニルオキシ基、3, 3, 3-トリフルオロプロピルオキシカルボニルオキシ基、シクロプロピルオキシカルボニルオキシ基、アミノカルボニルオキシ基、メチルアミノカルボニルオキシ基、エチルアミノカルボニルオキシ基、(メトキシメチル)アミノカルボニルオキシ基、(2-メトキシエチル)アミノカルボニルオキシ基、(シアノメチル)アミノカルボニルオキシ基、(2-シアノエチル)アミノカルボニルオキシ基、ジメチルアミノカルボニルオキシ基、エチルメチルアミノカルボニルオキシ基、ジエチルアミノカルボニルオキシ基、(メトキシメチル)メチルアミノカルボニルオキシ基、(2-メトキシエチル)メチルアミノカルボニルオキシ基、(シアノメチル)メチルアミノカルボニルオキシ基、(2-シアノエチル)メチルアミノカルボニルオキシ基、2, 2-ジフルオロエチルアミノカルボニルオキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノカルボニルオキシ基、シクロプロピルアミノカルボニルオキシ基、(シクロプロピル)メチルアミノカルボニルオキシ基、ピロリジニルカルボニルオキシ基、またはピペリジニルカルボニルオキシ基であり、さらに好ましくは、アセチルオキシ基、メトキシアセチルオキシ基、シアノアセチルオキシ基、ジフルオロアセチルオキシ基、トリフルオロアセチルオキシ基、メトキシカルボニルオキシ基、エトキシカルボニルオキシ基、アミノカルボニルオキシ基、ジメチルアミノカルボニルオキシ基、エチルメチルアミノカルボニルオキシ基、またはジエチルアミノカルボニルオキシ基である。

[0281] 式(1)の R_4 における「 $R \times 2 C(=O)N(R \times 3)-$ 」(ここで、 $R \times 2$ は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ のハロアルキル基、 $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ のアルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ のハロアルコキシ基、 $C_3 \sim C_8$ のシクロアルコキシ基、または $R^a R^b N-$ (ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。)を表し、 $R \times 3$ は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ のハロアルキル基、または $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル基を表す。)の各用語は、前記の定義と同義である。なお、「置換基Bで適宜置換されてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基」に関しては、置換基Bを有する場合、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基における水素原子が、置換基Bによって任意に置換される。 $R \times 2$ として、好ましくは、水素原子、メチル基、メトキシメチル基、シアノメチル基、エチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、シクロプロピル基、メトキシ基、エトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、シクロプロピルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、(メトキシメチル)アミノ基、(2-メトキシエチル)アミノ基、(シアノメチル)アミノ基、(2-シアノエチル)アミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、(メトキシメチル)メチルアミノ基、(2-メトキシエチル)メチルアミノ基、(シアノメチル)メチルアミノ基、(2-シアノエチル)メチルアミノ基、2, 2-ジフルオロエチルアミノ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ基、シクロプロピルアミノ基、(シクロプロピル)メチルアミノ基、ピロリジニル基、またはピペリジニル基であり、さらに好ましくは、水素原子、メチル基、メトキシメチル基、シアノメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基、エトキシ基、アミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、またはジエチルアミノ基である。また、 $R \times 3$ として、好ましくは、水素原子、メチル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、シアノメチル基、エチル基、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基、2-シアノエチル基

、プロピル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、またはシクロプロピル基であり、さらに好ましくは、水素原子、メチル基、メトキシメチル基、シアノメチル基、エチル基、2-メトキシエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、または2, 2, 2-トリフルオロエチル基である。

[0282] 式(1)のR₄における「R_{x4}R_{x5}C=N-O-」(ここで、R_{x4}およびR_{x5}は、それぞれ独立していて、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC₁~C₆のアルキル基、C₁~C₆のハロアルキル基、C₃~C₈のシクロアルキル基、C₁~C₆のアルコキシ基、C₁~C₆のハロアルコキシ基、C₃~C₈のシクロアルコキシ基、またはR_aR_bN- (ここで、R_aおよびR_bは、前記と同義である。)を表す。)の各用語は前記の定義と同義である。なお、「置換基Bで適宜置換されてもよいC₁~C₆のアルキル基」に関しては、置換基Bを有する場合、C₁~C₆のアルキル基における水素原子が、置換基Bによって任意に置換される。

[0283] R_{x4}およびR_{x5}として、好ましくは、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、メトキシ基、エトキシ基、イソプロピルオキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロブチルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、(メトキシメチル)アミノ基、(2-メトキシエチル)アミノ基、(シアノメチル)アミノ基、(2-シアノエチル)アミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、(メトキシメチル)メチルアミノ基、(2-メトキシエチル)メチルアミノ基、(シアノメチル)メチルアミノ基、(2-シアノエチル)メチルアミノ基、2, 2-ジフルオロエチルアミノ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ基、シクロプロピルアミノ基、(シクロプロピル)メチルアミノ基、ピロリジニル基、またはピペリジニル基で

あり、さらに好ましくは、メチル基、エチル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、メトキシ基、エトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、またはジエチルアミノ基である。

[0284] 式(1)のR₄における「1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、オキサニル基、オキサニル基、1, 3-ジオキサニル基、または1, 3-ジオキサニル基であり、さらに好ましくは、1, 3-ジオキサニル基、または1, 3-ジオキサニル基である。

[0285] 式(1)におけるR₅は、前記に記載のR₄と同義である。すなわち、水酸基、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、置換基Cで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルキル基、C₁～C₆のハロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₃～C₈のシクロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルケニル基、C₂～C₆ハロアルケニル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルキニル基、C₂～C₆のハロアルキニル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、C₁～C₆のハロアルコキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₃～C₈のシクロアルコキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルケニルオキシ基、C₂～C₆のハロアルケニルオキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₃～C₆のアルキニルオキシ基、C₃～C₆のハロアルキニルオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基、置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基、置換基Dで適宜置換されてもよいアリールオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリールオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキルオキシ基、R^aR^bN-（ここで、R^aおよびR^bは、前記と同義である。）、R^c-L-（ここで、R^cおよびLは、前記と同義である。）、R^x₁C(=O)-（ここでR^x₁は、前記と同義である。）、R^x₁C(=O)O-（ここでR^x₁は、前記と同義である。）、R^x₂C(=O)N(R^x₃)-（ここで、R^x₂および

び $R \times 3$ は、前記と同義である。)、 $R \times 4$ $R \times 5$ $C=N-O-$ (ここで、 $R \times 4$ および $R \times 5$ は前記と同義である。)、または 1～2 個の酸素原子を含む 3～6 員環の基を表す。

[0286] 中でも、 R^5 は、水酸基、シアノ基、ハロゲン原子、置換基 C で適宜置換されてもよい $C1 \sim C6$ のアルキル基、 $C1 \sim C6$ のハロアルキル基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C3 \sim C8$ のシクロアルキル基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C2 \sim C6$ のアルケニル基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C2 \sim C6$ のアルキニル基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C1 \sim C6$ のアルコキシ基、 $C1 \sim C6$ のハロアルコキシ基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C3 \sim C8$ のシクロアルコキシ基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C2 \sim C6$ のアルケニルオキシ基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C3 \sim C6$ のアルキニルオキシ基、 $R^a R^b N-$ (ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。)、 R^c-L- (ここで、 R^c および L は、前記と同義である。)、または $R \times 1 C(=O)O-$ (ここで $R \times 1$ は、前記と同義である。) が好ましく、

特に、水酸基、シアノ基、ハロゲン原子、置換基 C で適宜置換されてもよい $C1 \sim C6$ のアルキル基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C1 \sim C6$ のアルコキシ基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C2 \sim C6$ のアルケニルオキシ基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C3 \sim C6$ のアルキニルオキシ基、 $R^a R^b N-$ (ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。)、 R^c-L- (ここで、 R^c および L は、前記と同義である。)、または $R \times 1 C(=O)O-$ (ここで $R \times 1$ は、前記と同義である。) が好ましく、

さらに、水酸基、シアノ基、ハロゲン原子、置換基 C で適宜置換されてもよい $C1 \sim C6$ のアルコキシ基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C2 \sim C6$ のアルケニルオキシ基、置換基 C で適宜置換されてもよい $C3 \sim C6$ のアルキニルオキシ基、 $R^a R^b N-$ (ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。)、 R^c-L- (ここで、 R^c および L は、前記と同義である。)、または $R \times 1 C(=O)O-$ (ここで $R \times 1$ は、前記と同義である。) が

好ましい。

[0287] 式(1)のR⁵には、水酸基、シアノ基、およびニトロ基が含まれる。

[0288] 式(1)のR⁵におけるハロゲン原子は、前記の定義と同義であり、好ましくはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、またはヨウ素原子であり、さらに好ましくは、フッ素原子、またはヨウ素原子である。

[0289] 式(1)のR⁵における「置換基Cで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルキル基」のC₁～C₆のアルキル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、またはイソブチル基であり、さらに好ましくは、メチル基、またはエチル基である。置換基Cを有する場合、C₁～C₆のアルキル基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0290] 式(1)のR⁵における「C₁～C₆のハロアルキル基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、3, 3-ジフルオロプロピル基、または3, 3, 3-トリフルオロプロピル基であり、さらに好ましくは、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、または2, 2, 2-トリフルオロエチル基である。

[0291] 式(1)のR⁵における「置換基Cで適宜置換されてもよいC₃～C₈のシクロアルキル基」のC₃～C₈のシクロアルキル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、またはシクロヘキシル基であり、さらに好ましくは、シクロプロピル基、またはシクロブチル基である。置換基Cを有する場合、C₃～C₈のシクロアルキル基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0292] 式(1)のR⁵における「置換基Cで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルケニル基」のC₂～C₆のアルケニル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ビニル基、1-プロペニル基、アリル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、または3-ブテニル基であり、さらに好ましくは、ビニル基

、1-プロペニル基、またはアリル基である。置換基Cを有する場合、C2～C6のアルケニル基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0293] 式(1)のR5における「C2～C6のハロアルケニル基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、2-フルオロビニル基、2,2-ジフルオロビニル基、2,2-ジクロロビニル基、3-フルオロアリル基、3,3-ジフルオロアリル基、または3,3-ジクロロアリル基であり、さらに好ましくは、2-フルオロビニル基、または2,2-ジフルオロビニル基である。

[0294] 式(1)のR5における「置換基Cで適宜置換されてもよいC2～C6のアルキニル基」のC2～C6のアルキニル基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、エチニル基、1-プロピニル基、プロパルギル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、または3-ブチニル基であり、さらに好ましくは、エチニル基、1-プロピニル基、またはプロパルギル基である。置換基Cを有する場合、C2～C6のアルキニル基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0295] 式(1)のR5における「C2～C6のハロアルキニル基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、3,3-ジフルオロ-1-プロピニル基、3,3,3-トリフルオロ-1-プロピニル基、4,4-ジフルオロ-1-ブチニル基、4,4,4-トリフルオロ-1-ブチニル基、または4,4,4-トリフルオロ-2-ブチニル基であり、さらに好ましくは、3,3-ジフルオロ-1-プロピニル基、または3,3,3-トリフルオロ-1-プロピニル基である。

[0296] 式(1)のR5における「置換基Cで適宜置換されてもよいC1～C6のアルコキシ基」のC1～C6のアルコキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブトキシ基、またはイソブトキシ基であり、さらに好ましくは、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、またはイソプロピルオキシ基であり、特に好ましくは、メトキシ基、またはエトキシ基である。置換基Cを

有する場合、C 1～C 6のアルコキシ基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。置換基Cとして好ましくは、シアノ基、C 3～C 8のシクロアルキル基、C 1～C 6のアルコキシ基、C 1～C 6のハロアルコキシ基、C 2～C 6のアルコキシアルコキシ基、R_c-L-（ここで、R_cおよびLは、前記と同義である。）、R_x1C(=O)-（ここで、R_x1は、前記と同義である。）、または1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基であり、さらに好ましくは、シアノ基、C 1～C 6のアルコキシ基、またはR_c-L-（ここで、R_cおよびLは、前記と同義である。）である。置換基Cで置換されたC 1～C 6のアルコキシ基として好ましくは、シアノメトキシ基、シアノエトキシ基、メトキシメトキシ基、メトキシエトキシ基、エトキシメトキシ基、またはエトキシエトキシ基であり、さらに好ましくは、シアノメトキシ基、メトキシメトキシ基、またはメトキシエトキシ基であり、特に好ましくは、メトキシメトキシ基、またはメトキシエトキシ基である。

[0297] 式(1)のR₅における「C 1～C 6のハロアルコキシ基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、3, 3-ジフルオロプロピルオキシ基、または3, 3, 3-トリフルオロプロピルオキシ基であり、さらに好ましくは、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、または2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基である。

[0298] 式(1)のR₅における「置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルコキシ基」のC 3～C 8のシクロアルコキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、シクロプロピルオキシ基、シクロブトキシ基、シクロペンチルオキシ基、またはシクロヘキシルオキシ基であり、さらに好ましくは、シクロプロピルオキシ基、またはシクロブトキシ基である。置換基Cを有する場合、C 3～C 8のシクロアルコキシ基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0299] 式(1)のR⁵における「置換基Cで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルケニルオキシ基」のC₂～C₆のアルケニルオキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ビニルオキシ基、1-プロペニルオキシ基、アリルオキシ基、1-ブテニルオキシ基、2-ブテニルオキシ基、または3-ブテニルオキシ基であり、さらに好ましくは、ビニルオキシ基、1-プロペニルオキシ基、またはアリルオキシ基であり、特に好ましくは、アリルオキシ基である。置換基Cを有する場合、C₂～C₆のアルケニルオキシ基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0300] 式(1)のR⁵における「C₂～C₆のハロアルケニルオキシ基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、2-フルオロビニルオキシ基、2, 2-ジフルオロビニルオキシ基、2, 2-ジクロロビニルオキシ基、3-フルオロアリルオキシ基、3, 3-ジフルオロアリルオキシ基、または3, 3-ジクロロアリルオキシ基であり、さらに好ましくは、2-フルオロビニルオキシ基、または2, 2-ジフルオロビニルオキシ基である。

[0301] 式(1)のR⁵における「置換基Cで適宜置換されてもよいC₃～C₆のアルキニルオキシ基」のC₃～C₆のアルキニルオキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、プロパルギルオキシ基、2-ブチニルオキシ基、または3-ブチニルオキシ基であり、さらに好ましくは、プロパルギルオキシ基、または2-ブチニルオキシ基であり、特に好ましくは、プロパルギルオキシ基である。置換基Cを有する場合、C₃～C₆のアルキニルオキシ基における水素原子が、置換基Cによって任意に置換される。

[0302] 式(1)のR⁵における「C₃～C₆のハロアルキニルオキシ基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、4, 4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、4-クロロ-4, 4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、4-ブromo-4, 4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、または4, 4, 4-トリフルオロ-2-ブチニルオキシ基であり、さらに好ましくは、4, 4-ジフルオロ-2-ブチニルオキシ基、または4, 4, 4-トリフルオロ-2-ブチニルオキシ基である。

[0303] 式(1)のR⁵における「置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基」のアリール基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、フェニル基である。置換基Dを有する場合、アリール基における水素が、置換基Dによって任意に置換される。

[0304] 式(1)のR⁵における「置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基」のヘテロアリール基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ピリジル基、ピラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、フリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基、またはテトラゾリル基であり、さらに好ましくは、ピリジル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、トリアゾリル基、またはテトラゾリル基である。置換基Dを有する場合、ヘテロアリール基における水素が、置換基Dによって任意に置換される。

[0305] 式(1)のR⁵における「置換基Dで適宜置換されてもよいアリールオキシ基」のアリールオキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、フェノキシ基、またはナフチルオキシ基であり、さらに好ましくは、フェノキシ基である。置換基Dを有する場合、アリールオキシ基における水素原子が、置換基Dによって任意に置換される。

[0306] 式(1)のR⁵における「置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリールオキシ基」のヘテロアリールオキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ピリジルオキシ基、ピリダジニルオキシ基、ピリミジニルオキシ基、ピラジニルオキシ基、ピラゾリルオキシ基、トリアジニルオキシ基、テトラジニルオキシ基、チエニルオキシ基、チアゾリルオキシ基、イソチアゾリルオキシ基、またはチアジアゾリルオキシ基であり、さらに好ましくは、ピリジルオキシ基、ピリダジニルオキシ基、ピリミジニルオキシ基、ピラジニルオキシ基、またはピラゾリルオキシ基である。置換基Dを有する場合、ヘテロアリールオキシ基における水素原子が、置換基Dによって任意に置換される。

[0307] 式(1)のR⁵における「置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキルオ

キシ基」のアラルキルオキシ基は、前記の定義と同義であり、好ましくは、ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基、またはフェニルプロピルオキシ基であり、さらに好ましくは、ベンジルオキシ基、またはフェネチルオキシ基である。置換基Dを有する場合、アラルキルオキシ基における水素原子が、置換基Dによって任意に置換される。

[0308] 式(1)のR⁵における「R^aR^bN-」のR^aおよびR^bは、前記と同義である。R^aおよびR^bとして、好ましくは、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC¹~C⁶のアルキル基、C¹~C⁶のハロアルキル基、C³~C⁸のシクロアルキル基、ピロリジニル基、またはピペリジニル基であり、さらに好ましくは、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC¹~C⁶のアルキル基、ピロリジニル基、またはピペリジニル基である。「R^aR^bN-」として好ましくは、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、(メトキシメチル)アミノ基、(2-メトキシエチル)アミノ基、(シアノメチル)アミノ基、(2-シアノエチル)アミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、(メトキシメチル)メチルアミノ基、(2-メトキシエチル)メチルアミノ基、(シアノメチル)メチルアミノ基、(2-シアノエチル)メチルアミノ基、2,2-ジフルオロエチルアミノ基、2,2,2-トリフルオロエチルアミノ基、シクロプロピルアミノ基、(シクロプロピル)メチルアミノ基、ピロリジニル基、またはピペリジニル基であり、さらに好ましくは、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ピロリジニル基、またはピペリジニル基であり、特に好ましくは、メチルアミノ基、ピロリジニル基、またはピペリジニル基である。

[0309] 式(1)のR⁵における「R^c-L-」のR^cおよびLは、前記と同義である。R^cとして、好ましくは、C¹~C⁶のアルキル基である。Lとして、好ましくは、Sである。「R^c-L-」として、好ましくは、メチルチオ基、メタンスルフィニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメチルチオ基、トリフルオロメタンスルフィニル基、またはトリフルオロメタンスルホ

ニル基であり、さらに好ましくは、メチルチオ基、メタンスルフィニル基、またはメタンスルホニル基であり、特に好ましくはメチルチオ基である。

[0310] 式(1)のR⁵における「R_x1C(=O)―」のR_x1は、前記の定義と同義である。「R_x1C(=O)―」として、好ましくは、アセチル基、メトキシアセチル基、シアノアセチル基、プロピオニル基、ジフルオロアセチル基、トリフルオロアセチル基、シクロプロパンカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、2, 2-ジフルオロエトキシカルボニル基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル基、3, 3, 3-トリフルオロプロピルオキシカルボニル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、アミノカルボニル基、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニル基、(メトキシメチル)アミノカルボニル基、(2-メトキシエチル)アミノカルボニル基、(シアノメチル)アミノカルボニル基、(2-シアノエチル)アミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、エチルメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、(メトキシメチル)メチルアミノカルボニル基、(2-メトキシエチル)メチルアミノカルボニル基、(シアノメチル)メチルアミノカルボニル基、(2-シアノエチル)メチルアミノカルボニル基、2, 2-ジフルオロエチルアミノカルボニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノカルボニル基、シクロプロピルアミノカルボニル基、(シクロプロピル)メチルアミノカルボニル基、ピロリジニルカルボニル基、またはピペリジニルカルボニル基であり、さらに好ましくは、アセチル基、メトキシアセチル基、シアノアセチル基、ジフルオロアセチル基、トリフルオロアセチル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、アミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、エチルメチルアミノカルボニル基、またはジエチルアミノカルボニル基である。

[0311] 式(1)のR⁵における「R_x1C(=O)O―」のR_x1は、前記の定義と同義である。R_x1として、好ましくは、置換基Bで適宜置換されてもよいC₁~C₆のアルキル基、C₁~C₆のハロアルキル基、C₃~C₈のシクロアルキル基、C₁~C₆のアルコキシ基、C₁~C₆のハロアルコキ

シ基、C 3～C 8のシクロアルコキシ基、またはR a R b N-（ここで、R a およびR b は前記と同義である。）であり、さらに好ましくは、置換基Bで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、C 1～C 6のアルコキシ基、またはR a R b N-（ここで、R a およびR b は前記と同義である。）であり、特に好ましくは、置換基Bで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基である。「R x 1 C (=O) O-」として、好ましくは、アセチルオキシ基、メトキシアセチルオキシ基、シアノアセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、ジフルオロアセチルオキシ基、トリフルオロアセチルオキシ基、シクロプロパンカルボニルオキシ基、メトキシカルボニルオキシ基、エトキシカルボニルオキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシカルボニルオキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニルオキシ基、3, 3, 3-トリフルオロプロピルオキシカルボニルオキシ基、シクロプロピルオキシカルボニルオキシ基、アミノカルボニルオキシ基、メチルアミノカルボニルオキシ基、エチルアミノカルボニルオキシ基、（メトキシメチル）アミノカルボニルオキシ基、（2-メトキシエチル）アミノカルボニルオキシ基、（シアノメチル）アミノカルボニルオキシ基、（2-シアノエチル）アミノカルボニルオキシ基、ジメチルアミノカルボニルオキシ基、エチルメチルアミノカルボニルオキシ基、ジエチルアミノカルボニルオキシ基、（メトキシメチル）メチルアミノカルボニルオキシ基、（2-メトキシエチル）メチルアミノカルボニルオキシ基、（シアノメチル）メチルアミノカルボニルオキシ基、（2-シアノエチル）メチルアミノカルボニルオキシ基、2, 2-ジフルオロエチルアミノカルボニルオキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノカルボニルオキシ基、シクロプロピルアミノカルボニルオキシ基、（シクロプロピル）メチルアミノカルボニルオキシ基、ピロリジニルカルボニルオキシ基、またはピペリジニルカルボニルオキシ基であり、さらに好ましくは、アセチルオキシ基、メトキシアセチルオキシ基、シアノアセチルオキシ基、ジフルオロアセチルオキシ基、トリフルオロアセチルオキシ基、メトキシカルボニルオキシ基、エトキシカルボニル

オキシ基、アミノカルボニルオキシ基、ジメチルアミノカルボニルオキシ基、エチルメチルアミノカルボニルオキシ基、またはジエチルアミノカルボニルオキシ基であり、特に好ましくはアセチルオキシ基である。

[0312] 式(1)のR⁵における「R_{x2}C(=O)N(R_{x3})-」(ここで、R_{x2}は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC₁~C₆のアルキル基、C₁~C₆のハロアルキル基、C₃~C₈のシクロアルキル基、C₁~C₆のアルコキシ基、C₁~C₆のハロアルコキシ基、C₃~C₈のシクロアルコキシ基、またはR^aR^bN- (ここで、R^aおよびR^bは、前記と同義である。)を表し、R_{x3}は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC₁~C₆のアルキル基、C₁~C₆のハロアルキル基、またはC₃~C₈のシクロアルキル基を表す。)の各用語は、前記の定義と同義である。なお、「置換基Bで適宜置換されてもよいC₁~C₆のアルキル基」に関しては、置換基Bを有する場合、C₁~C₆のアルキル基における水素原子が、置換基Bによって任意に置換される。R_{x2}として、好ましくは、水素原子、メチル基、メトキシメチル基、シアノメチル基、エチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、シクロプロピル基、メトキシ基、エトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、シクロプロピルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、(メトキシメチル)アミノ基、(2-メトキシエチル)アミノ基、(シアノメチル)アミノ基、(2-シアノエチル)アミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、(メトキシメチル)メチルアミノ基、(2-メトキシエチル)メチルアミノ基、(シアノメチル)メチルアミノ基、(2-シアノエチル)メチルアミノ基、2, 2-ジフルオロエチルアミノ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ基、シクロプロピルアミノ基、(シクロプロピル)メチルアミノ基、ピロリジニル基、またはピペリジニル基であり、さらに好ましくは、水素原子、メチル基、メトキシメチル基、シアノメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基、エトキシ基、アミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ま

たはジエチルアミノ基である。また、 $R \times 3$ として、好ましくは、水素原子、メチル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、シアノメチル基、エチル基、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基、2-シアノエチル基、プロピル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、またはシクロプロピル基であり、さらに好ましくは、水素原子、メチル基、メトキシメチル基、シアノメチル基、エチル基、2-メトキシエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、または2, 2, 2-トリフルオロエチル基である。

[0313] 式(1)の R_5 における「 $R \times 4 R \times 5 C=N-O-$ 」(ここで、 $R \times 4$ および $R \times 5$ は、それぞれ独立していて、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ のハロアルキル基、 $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ のアルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ のハロアルコキシ基、 $C_3 \sim C_8$ のシクロアルコキシ基、または $R^a R^b N-$ (ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。)を表す。)の各用語は前記の定義と同義である。なお、「置換基Bで適宜置換されてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基」に関しては、置換基Bを有する場合、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基における水素原子が、置換基Bによって任意に置換される。

[0314] $R \times 4$ および $R \times 5$ として、好ましくは、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、メトキシ基、エトキシ基、イソプロピルオキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロブチルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、(メトキシメチル)アミノ基、(2-メトキシエチル)アミノ基、(シアノメチル)アミノ基、(2-シアノエチル)アミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、(メトキシメチル)メチルアミノ基、(2-メトキシエチル)メチルアミノ基、(シアノメチル)メチルアミノ基、(

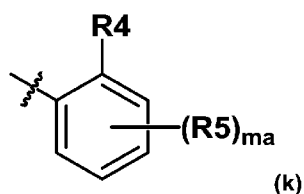
2-シアノエチル)メチルアミノ基、2, 2-ジフルオロエチルアミノ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ基、シクロプロピルアミノ基、(シクロプロピル)メチルアミノ基、ピロリジニル基、またはピペリジニル基であり、さらに好ましくは、メチル基、エチル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、メトキシ基、エトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、またはジエチルアミノ基である。

[0315] 式(1)のR5における「1~2個の酸素原子を含む3~6員環の基」は、前記の定義と同義であり、好ましくは、オキサニル基、オキサニル基、1, 3-ジオキサニル基、または1, 3-ジオキサニル基であり、さらに好ましくは、1, 3-ジオキサニル基、または1, 3-ジオキサニル基である。

[0316] 以下、式(1)のYについて詳細に説明する。

[0317] A) Yがフェニル基であるとき、Yは、式(k)

[化71]



で表される部分構造(ここで、R4およびR5は前記と同義であり、maは0~4の整数を表す。)を表す。

[0318] 式(k)のmaは、0~4の整数を表す。

[0319] 式(k)のmaが2以上の場合、2以上のR5は、それぞれ独立した置換基を表し、同一または異なっていてよく、任意に選択することができる。

[0320] 本明細書においてYがフェニル基の場合、オルト位とは、式(k)に示されるように、置換基R4があるフェニル基の位置を意味する。

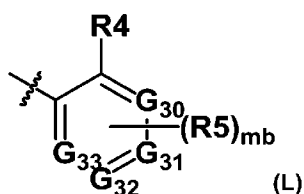
[0321] 置換基R4がオルト位に位置したフェニル基は、本発明の特徴をなしている。

[0322] 式(k)の好ましい置換基の組み合わせは、2-R4-フェニル基、2-

R4-6-R5-フェニル基、2-R4-4-R5-フェニル基、2-R4-4-R5-6-R5-フェニル基、2-R4-3-R5-フェニル基、または2-R4-3-R5-4-R5-6-R5-フェニル基であり、さらに好ましい置換基の組み合わせは、2-R4-フェニル基、2-R4-6-R5-フェニル基、2-R4-4-R5-フェニル基、2-R4-4-R5-6-R5-フェニル基、または2-R4-3-R5-4-R5-6-R5-フェニル基である。ここで例えば、「2-R4-6-R5-フェニル基」は、2位に置換基R4、6位に置換基R5を有する二置換フェニル基を意味し、以下の記載も同様である。

[0323] B) Yが、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、またはテトラジニル基のとき、Yは、式(L)

[化72]



で表される部分構造（ここで、R4、R5は前記と同義であり、mbは0～3の整数を表す。）を表す。

[0324] 式(L)のG30、G31、G32およびG33は、それぞれ独立していて、炭素原子または窒素原子を表す。ただし、G30、G31、G32およびG33のうち、少なくとも一つは窒素原子である。好ましいG30、G31、G32およびG33は、G30、G31、G32およびG33のうち、いずれか一つが窒素原子である。すなわち、ピリジル基である。

[0325] 式(L)のmbは、0～3の整数を表す。

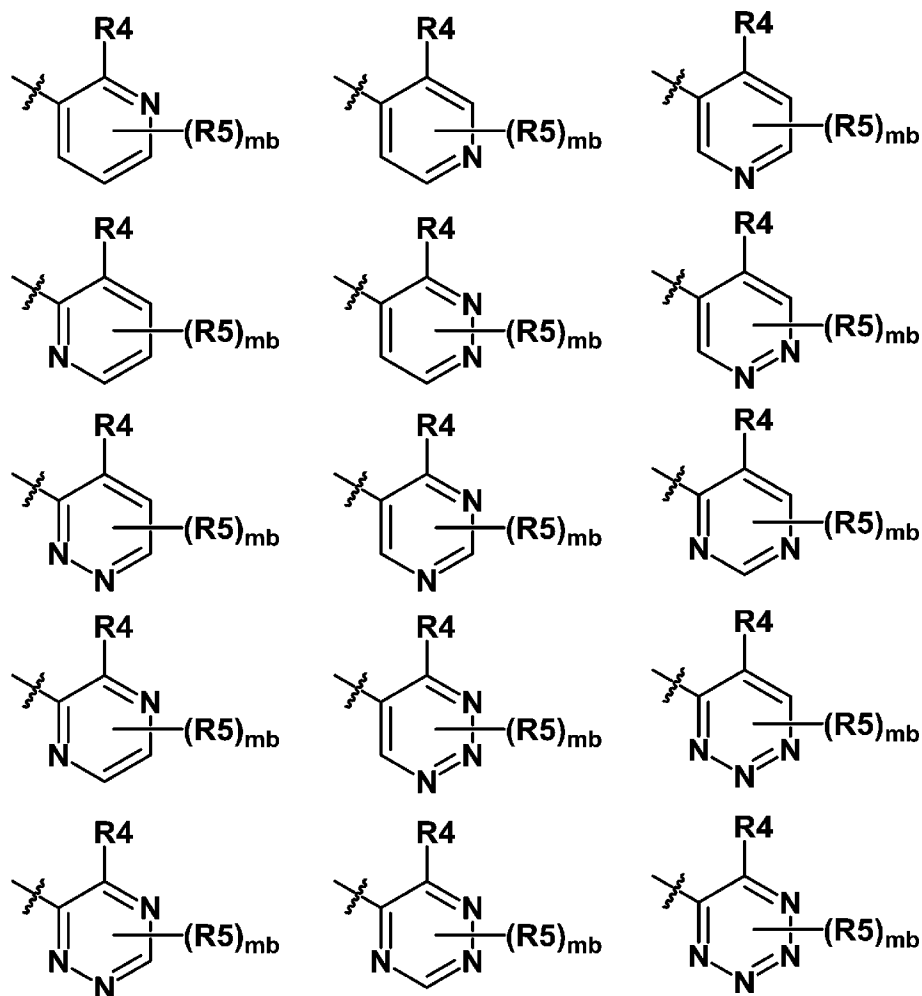
[0326] 式(L)のmbが2以上の場合、2以上のR5は、それぞれ独立した置換基を表し、同一、または異なっていてよく、任意に選択することができる。

[0327] 本明細書においてYがピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、またはテトラジニル基の場合、オルト位とは

、式（L）に示されるように、置換基 R₄ がある 6 員環の位置を意味する。

[0328] 式（L）で表される部分構造の具体例を以下に示す。

[化73]



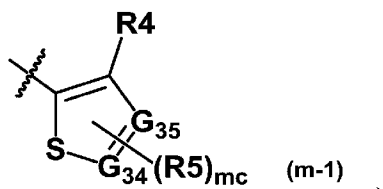
[0329] 置換基 R₄ がオルト位に位置したピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、またはテトラジニル基は、本発明の特徴をなしている。

[0330] 式（L）の好ましい具体例は、3-R₄-ピリジン-2-イル基、3-R₄-4-R₅-ピリジン-2-イル基、2-R₄-ピリジン-3-イル基、2-R₄-4-R₅-ピリジン-3-イル基、2-R₄-6-R₅-ピリジン-3-イル基、2-R₄-4-R₅-6-R₅-ピリジン-3-イル基、4-R₄-ピリジン-3-イル基、4-R₄-2-R₅-ピリジン-3-イル基、4-R₄-6-R₅-ピリジン-3-イル基、4-R₄-2-R₅-

6-R5-ピリジン-3-イル基、3-R4-ピリジン-4-イル基、または3-R4-5-R5-ピリジン-4-イル基である。

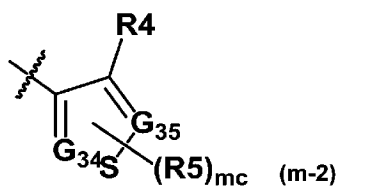
[0331] C) Yが、チエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、またはチアジアゾリル基のとき、Yは、式(m-1)

[化74]



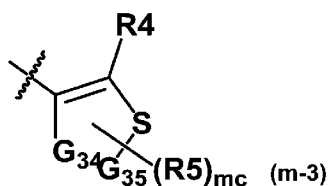
式(m-2)

[化75]



または、式(m-3)

[化76]



で表される部分構造（ここで、R4およびR5は前記と同義であり、mcは0～2の整数を表す。）を表す。

[0332] 式(m-1)、式(m-2)および式(m-3)におけるG34とG35は、それぞれ独立していて、炭素原子または窒素原子を表す。

[0333] 式(m-1)、式(m-2)および式(m-3)のmcは、0～2の整数を表す。

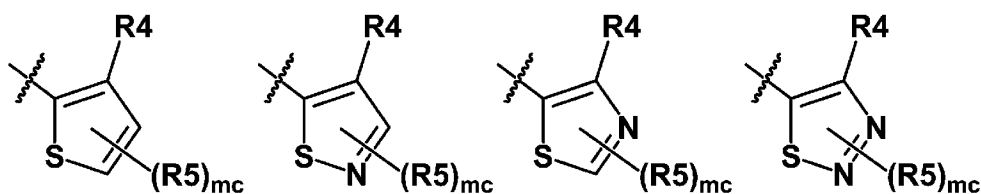
[0334] 式(m-1)、式(m-2)および式(m-3)のmcが2の場合、2のR5は、それぞれ独立した置換基を表し、同一または異なっていてよく、任

意に選択することができる。

[0335] 本明細書においてYがチエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、またはチアジアゾリル基の場合、オルト位とは、式(m-1)、式(m-2)および式(m-3)に示されるように、R₄がある5員環の位置を意味する。

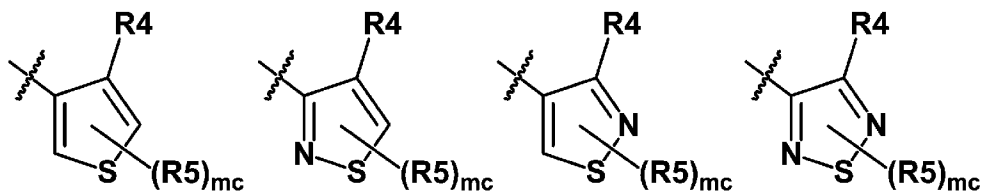
[0336] 式(m-1)で表される部分構造の具体例を以下に示す。

[化77]



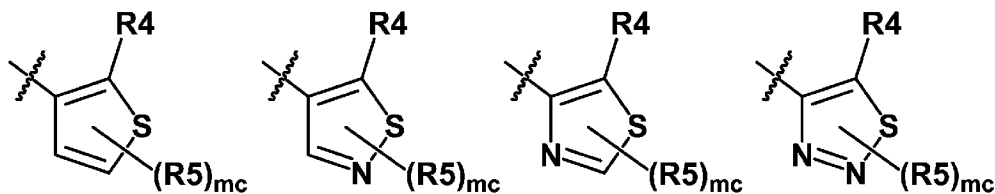
[0337] 式(m-2)で表される部分構造の具体例を以下に示す。

[化78]



[0338] 式(m-3)で表される部分構造の具体例を以下に示す。

[化79]



[0339] R₄がオルト位に位置したチエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、またはチアジアゾリル基は、本発明の特徴をなしている。

[0340] 式(1)のXは、酸素原子、または硫黄原子を表す。好ましいXは、酸素原子である。

[0341] 式(1)における破線部を含む結合は、

[化80]

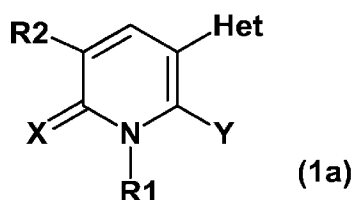


で表される箇所を表す。

[0342] 式(1)における破線部を含む結合は、二重結合または単結合を表す。

[0343] 式(1)における破線部を含む結合が二重結合の場合は、式(1a)

[化81]

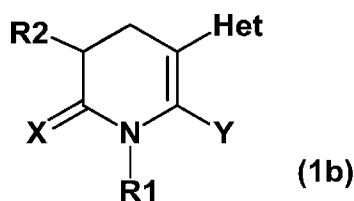


(式中、R1、R2、Het、X、およびYは、式(1)と同義である。)

で表される化合物、またはその塩を表す。

[0344] 式(1)における破線部を含む結合が単結合の場合は、式(1b)

[化82]



(式中、R1、R2、Het、X、およびYは、式(1)と同義である。)

で表される化合物、またはその塩を表す。

[0345] 式(1b)におけるR2が水素以外の置換基の場合、R体もしくはS体のどちらか一方のみ、またはR体とS体との任意の割合の混合物である。

[0346] 式(1)の「置換基A」は、水酸基、シアノ基、C3～C8のシクロアルキル基、C1～C6のアルコキシ基、C1～C6のハロアルコキシ基、C3～C8のシクロアルコキシ基、RaRbN-（ここで、RaおよびRbは、前記と同義である。）、およびRc-L-（ここで、RcおよびLは、前記と同義である。）からなる群から選択される少なくとも1種を表す。

[0347] 中でも置換基Aは、シアノ基、C1～C6のアルコキシ基、またはRc-

L-（ここで、R_cおよびLは、前記と同義である。）が好ましく、
特に、シアノ基、またはC₁～C₆のアルコキシ基が好ましい。

[0348] 置換基Aの好ましい具体例に関しては、水酸基；シアノ基；

C₃～C₈のシクロアルキル基として、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、およびシクロヘキシル基；

C₁～C₆のアルコキシ基として、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、およびイソプロピルオキシ基；

C₁～C₆のハロアルコキシ基として、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、3, 3-ジフルオロプロピルオキシ基、および3, 3, 3-トリフルオロプロピルオキシ基；

C₃～C₈のシクロアルコキシ基として、シクロプロピルオキシ基、シクロブトキシ基、シクロペンチルオキシ基、およびシクロヘキシルオキシ基；

R_aR_bN-（ここで、R_aおよびR_bは、前記と同義である。）として、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、（メトキシメチル）アミノ基、（2-メトキシエチル）アミノ基、（シアノメチル）アミノ基、（2-シアノエチル）アミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、（メトキシメチル）メチルアミノ基、（2-メトキシエチル）メチルアミノ基、（シアノメチル）メチルアミノ基、（2-シアノエチル）メチルアミノ基、2, 2-ジフルオロエチルアミノ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ基、シクロプロピルアミノ基、（シクロプロピル）メチルアミノ基、ピロリジニル基、およびピペリジニル基；

ならびにR_c-L-（ここで、R_cおよびLは、前記と同義である。）として、メチルチオ基、メタンスルフィニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメチルチオ基、トリフルオロメタンスルフィニル基、およびトリフルオロメタンスルホニル基である。

[0349] 置換基Aのさらに好ましい具体例に関しては、水酸基；シアノ基；

C₃～C₈のシクロアルキル基として、シクロプロピル基、およびシクロブ

チル基、

C 1 ～ C 6 のアルコキシ基として、メトキシ基、およびエトキシ基、

C 1 ～ C 6 のハロアルコキシ基として、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、および2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、

C 3 ～ C 8 のシクロアルコキシ基として、シクロプロピルオキシ基、およびシクロブトキシ基、

R a R b N-（ここで、R a およびR b は、前記と同義である。）として、

ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、およびジエチルアミノ基、

ならびにR c -L-（ここで、R c およびL は、前記と同義である。）として、メチルチオ基、メタンスルフィニル基、およびメタンスルホニル基である。

[0350] 式（1）の「置換基B」は、シアノ基、C 1 ～ C 6 のアルコキシ基、C 1 ～ C 6 のハロアルコキシ基、およびC 3 ～ C 8 のシクロアルコキシ基からなる群から選択される少なくとも1種を表す。

[0351] 中でも置換基Bは、シアノ基、またはC 1 ～ C 6 のアルコキシ基が好ましい。

[0352] 置換基Bの好ましい具体例に関しては、シアノ基；

C 1 ～ C 6 のアルコキシ基として、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、およびイソプロピルオキシ基；

C 1 ～ C 6 のハロアルコキシ基として、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、3, 3-ジフルオロプロピルオキシ基、および3, 3, 3-トリフルオロプロピルオキシ基；

ならびにC 3 ～ C 8 のシクロアルコキシ基として、シクロプロピルオキシ基、シクロブトキシ基、シクロペンチルオキシ基、およびシクロヘキシルオキシ基である。

[0353] 置換基Bのさらに好ましい具体例に関しては、シアノ基；

C 1～C 6のアルコキシ基として、メトキシ基、およびエトキシ基；

C 1～C 6のハロアルコキシ基として、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2，2-ジフルオロエトキシ基、および2，2，2-トリフルオロエトキシ基；

ならびにC 3～C 8のシクロアルコキシ基として、シクロプロピルオキシ基、およびシクロブトキシ基が挙げられる。

[0354] 式(1)の「置換基C」とは、水酸基、シアノ基、C 3～C 8のシクロアルキル基、C 1～C 6のアルコキシ基、C 1～C 6のハロアルコキシ基、C 3～C 8のシクロアルコキシ基、C 2～C 6のアルコキシアルコキシ基、R^aR^bN-（ここで、R^aおよびR^bは、前記と同義である。）、R^c-L-（ここで、R^cおよびLは、前記と同義である。）、R_{x1}C(=O)-（ここで、R_{x1}は、前記と同義である。）、および1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基からなる群から選択される少なくとも1種を表し、

中でも置換基Cは、シアノ基、C 3～C 8のシクロアルキル基、C 1～C 6のアルコキシ基、C 1～C 6のハロアルコキシ基、C 2～C 6のアルコキシアルコキシ基、R^c-L-（ここで、R^cおよびLは、前記と同義である。）、R_{x1}C(=O)-（ここで、R_{x1}は、前記と同義である。）、または1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基が好ましく、

特に、シアノ基、C 1～C 6のアルコキシ基、またはR^c-L-（ここで、R^cおよびLは、前記と同義である。）が好ましい。

[0355] 置換基Cの好ましい具体例に関しては、水酸基；シアノ基；

C 3～C 8のシクロアルキル基として、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、およびシクロヘキシル基；

C 1～C 6のアルコキシ基として、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、およびt-ブトキシ基；

C 1～C 6のハロアルコキシ基として、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2，2-ジフルオロエトキシ基、2，2，2-トリフルオロ

エトキシ基、3, 3-ジフルオロプロピルオキシ基、および3, 3, 3-トリフルオロプロピルオキシ基；

C3～C8のシクロアルコキシ基として、シクロプロピルオキシ基、シクロブトキシ基、シクロペンチルオキシ基、およびシクロヘキシルオキシ基；

C2～C6のアルコキシアルコキシ基として、メトキシメトキシ基、エトキシメトキシ基、メトキシエトキシ基、エトキシエトキシ基、およびメトキシプロピルオキシ基；

R^aR^bN-（ここで、R^aおよびR^bは、前記と同義である。）として、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、（メトキシメチル）アミノ基、（2-メトキシエチル）アミノ基、（シアノメチル）アミノ基、（2-シアノエチル）アミノ基、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、（メトキシメチル）メチルアミノ基、（2-メトキシエチル）メチルアミノ基、（シアノメチル）メチルアミノ基、（2-シアノエチル）メチルアミノ基、2, 2-ジフルオロエチルアミノ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ基、シクロプロピルアミノ基、（シクロプロピル）メチルアミノ基、ピロリジニル基、およびピペリジニル基；

R^c-L-（ここで、R^cおよびLは、前記と同義である。）として、メチルチオ基、メタンスルフィニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメチルチオ基、トリフルオロメタンスルフィニル基、およびトリフルオロメタンスルホニル基；

R^x1C(=O)-（ここで、R^x1は、前記と同義である。）として、ホルミル基、アセチル基、メトキシアセチル基、シアノアセチル基、プロピオニル基、ジフルオロアセチル基、トリフルオロアセチル基、シクロプロパンカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、2, 2-ジフルオロエトキシカルボニル基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル基、3, 3, 3-トリフルオロプロピルオキシカルボニル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、アミノカルボニル基、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニル基、（メトキシメチル）アミノカルボニル基、

(2-メトキシエチル) アミノカルボニル基、(シアノメチル) アミノカルボニル基、(2-シアノエチル) アミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、エチルメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、(メトキシメチル) メチルアミノカルボニル基、(2-メトキシエチル) メチルアミノカルボニル基、(シアノメチル) メチルアミノカルボニル基、(2-シアノエチル) メチルアミノカルボニル基、2, 2-ジフルオロエチルアミノカルボニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノカルボニル基、シクロプロピルアミノカルボニル基、(シクロプロピル) メチルアミノカルボニル基、ピロリジニルカルボニル基、およびピペリジニルカルボニル基；

ならびに1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基として、オキサニル基、オキサニル基、1, 3-ジオキサニル基、および1, 3-ジオキサニル基である。

[0356] 置換基Cのさらに好ましい具体例に関しては、水酸基；シアノ基；

C3～C8のシクロアルキル基として、シクロプロピル基、およびシクロブチル基；

C1～C6のアルコキシ基として、メトキシ基、およびエトキシ基；

C1～C6のハロアルコキシ基として、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、および2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基；

C3～C8のシクロアルコキシ基として、シクロプロピルオキシ基、およびシクロブトキシ基；

C2～C6のアルコキシアルコキシ基として、メトキシメトキシ基、エトキシメトキシ基、メトキシエトキシ基、およびエトキシエトキシ基；

R^aR^bN-（ここで、R^aおよびR^bは、前記と同義である。）として、ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、およびジエチルアミノ基；

R^c-L-（ここで、R^cおよびLは、前記と同義である。）として、メチルチオ基、メタンスルフィニル基、およびメタンスルホニル基；

$R \times 1 C (=O) -$ （ここで、 $R \times 1$ は、前記と同義である。）として、ホルミル基、アセチル基、メトキシアセチル基、シアノアセチル基、ジフルオロアセチル基、トリフルオロアセチル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、アミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、エチルメチルアミノカルボニル基、およびジエチルアミノカルボニル基；
ならびに1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基として、1, 3-ジオキサニル基、および1, 3-ジオキサニル基である。

[0357] 式(1)の「置換基D」とは、水酸基、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、C3～C8のシクロアルキル基、C1～C6のアルコキシ基、C1～C6のハロアルコキシ基およびC3～C8のシクロアルコキシ基からなる群から選択される少なくとも1種を表す。

[0358] 中でも置換基Dは、シアノ基、ハロゲン原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、C1～C6のアルコキシ基またはC1～C6のハロアルコキシ基が好ましい。

[0359] 置換基Dの好ましい具体例に関しては、水酸基；シアノ基；ニトロ基；ハロゲン原子として、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、およびヨウ素原子；

置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基として、メチル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、シアノメチル基、エチル基、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基、2-シアノエチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、およびイソブチル基；

C1～C6のハロアルキル基として、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、3, 3-ジフルオロプロピル基、および3, 3, 3-トリフルオロプロピル基；

C3～C8のシクロアルキル基として、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、およびシクロヘキシル基；

C 1～C 6のアルコキシ基として、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、およびt-ブトキシ基；

C 1～C 6のハロアルコキシ基として、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、3, 3-ジフルオロプロピルオキシ基、および3, 3, 3-トリフルオロプロピルオキシ基；

ならびに、C 3～C 8のシクロアルコキシ基として、シクロプロピルオキシ基、シクロブトキシ基、シクロペンチルオキシ基、およびシクロヘキシルオキシ基である。

[0360] 置換基Dのさらに好ましい具体例に関しては、水酸基；シアノ基；ニトロ基；

ハロゲン原子として、フッ素原子、塩素原子、および臭素原子；

置換基Bで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基として、メチル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、シアノメチル基、エチル基、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基、および2-シアノエチル基；

C 1～C 6のハロアルキル基として、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、および2, 2, 2-トリフルオロエチル基；

C 3～C 8のシクロアルキル基として、シクロプロピル基、およびシクロブチル基；

C 1～C 6のアルコキシ基として、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、およびイソプロピルオキシ基；

C 1～C 6のハロアルコキシ基として、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2-ジフルオロエトキシ基、および2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基；

ならびにC 3～C 8のシクロアルコキシ基として、シクロプロピルオキシ基、およびシクロブトキシ基が挙げられる。

[0361] 式(1)で表される化合物は、1個または2個の軸不斉を有することがある。この際の異性体比は、単独または任意の割合の混合比であり、特に限定されることはない。

[0362] 式(1)で表される化合物は、不斉原子を含むことがある。この際の異性体比は、単独または任意の割合の混合比であり、特に限定されることはない。

[0363] 式(1)で表される化合物は、幾何異性体を含むことがある。この際の異性体比は、単独または任意の割合の混合比であり、特に限定されることはない。

[0364] 式(1)で表される化合物は、塩を形成できることがある。塩酸、硫酸、酢酸、フマル酸、マレイン酸のような酸塩や、ナトリウム、カリウム、カルシウムのような金属塩等が例示されるが、農園芸用殺菌剤として使用できる限り、特に限定されることはない。

[0365] 以上説明したR₁、R₂、Het、R₃、Y、R₄、R₅、X、破線部を含む結合、置換基A、置換基B、置換基C、および置換基Dにおける好ましい範囲を任意に組み合わせて得られる全ての化合物の範囲も本発明の式(1)またはその製造中間体化合物の範囲として記載されているものとする。

[0366] 次に、本発明の具体的な化合物は、表1に示す構造式P-1～P-77（ここで、表1中のXは酸素原子、または硫黄原子であり、破線部を含む結合は、二重結合または単結合を表す。）と、表2に示すY（ここで、Yは前記と同義である。）の構造式（Y-1～Y-408）と、表3に示すHet（ここで、Hetは前記と同義である。）の構造式（Het-1～Het-2880）との組み合わせによって表される。これらの化合物は例示のためのものであって、本発明はこれらに限定されるものではない。

[0367]

[表1-1]

表 1

P-1	P-2	P-3	P-4
P-5	P-6	P-7	P-8
P-9	P-10	P-11	P-12
P-13	P-14	P-15	P-16
P-17	P-18	P-19	P-20
P-21	P-22	P-23	P-24
P-25	P-26	P-27	P-28

[表1-2]

表 1 の続き

<u>P-29</u>	<u>P-30</u>	<u>P-31</u>	<u>P-32</u>
<u>P-33</u>	<u>P-34</u>	<u>P-35</u>	<u>P-36</u>
<u>P-37</u>	<u>P-38</u>	<u>P-39</u>	<u>P-40</u>
<u>P-41</u>	<u>P-42</u>	<u>P-43</u>	<u>P-44</u>
<u>P-45</u>	<u>P-46</u>	<u>P-47</u>	<u>P-48</u>
<u>P-49</u>	<u>P-50</u>	<u>P-51</u>	<u>P-52</u>
<u>P-53</u>	<u>P-54</u>	<u>P-55</u>	<u>P-56</u>

[表1-3]

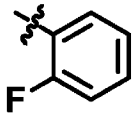
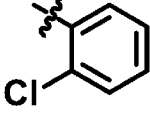
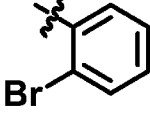
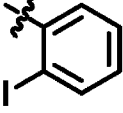
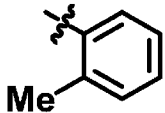
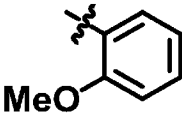
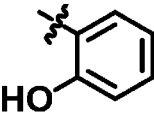
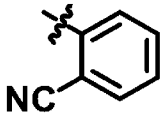
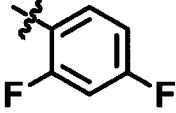
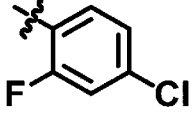
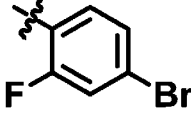
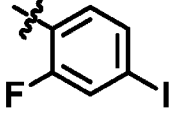
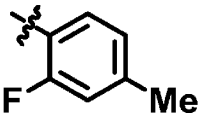
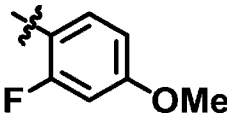
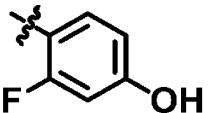
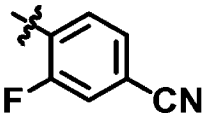
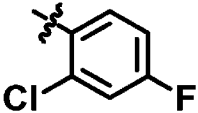
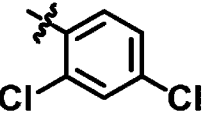
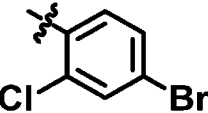
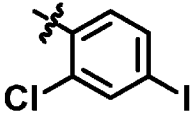
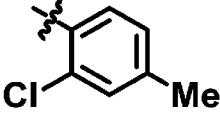
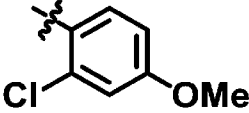
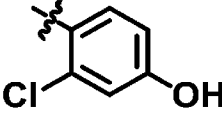
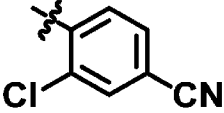
表 1 の続き

<u>P-57</u>	<u>P-58</u>	<u>P-59</u>	<u>P-60</u>
<u>P-61</u>	<u>P-62</u>	<u>P-63</u>	<u>P-64</u>
<u>P-65</u>	<u>P-66</u>	<u>P-67</u>	<u>P-68</u>
<u>P-69</u>	<u>P-70</u>	<u>P-71</u>	<u>P-72</u>
<u>P-73</u>	<u>P-74</u>	<u>P-75</u>	<u>P-76</u>
<u>P-77</u>			

[0370]

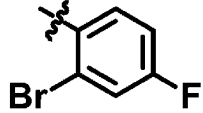
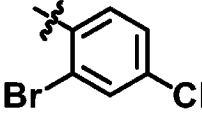
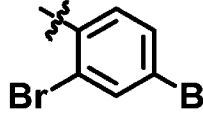
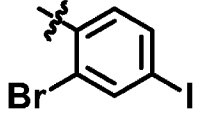
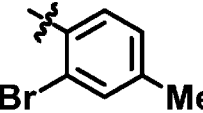
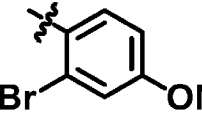
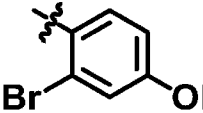
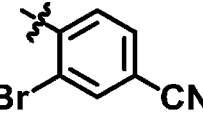
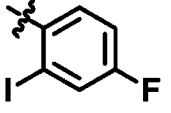
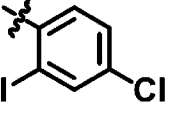
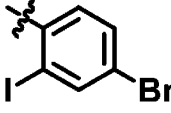
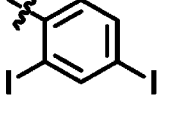
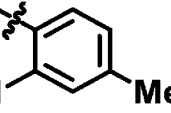
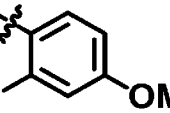
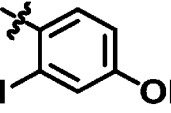
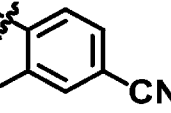
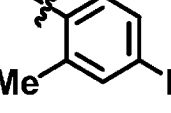
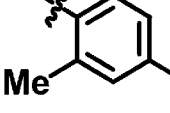
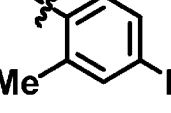
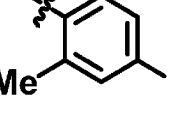
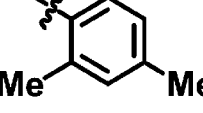
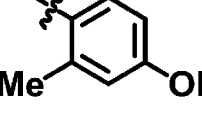
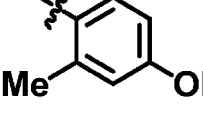
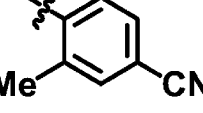
[表2-1]

表 2

<u>Y-1</u>	<u>Y-2</u>	<u>Y-3</u>	<u>Y-4</u>
			
<u>Y-5</u>	<u>Y-6</u>	<u>Y-7</u>	<u>Y-8</u>
			
<u>Y-9</u>	<u>Y-10</u>	<u>Y-11</u>	<u>Y-12</u>
			
<u>Y-13</u>	<u>Y-14</u>	<u>Y-15</u>	<u>Y-16</u>
			
<u>Y-17</u>	<u>Y-18</u>	<u>Y-19</u>	<u>Y-20</u>
			
<u>Y-21</u>	<u>Y-22</u>	<u>Y-23</u>	<u>Y-24</u>
			

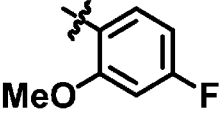
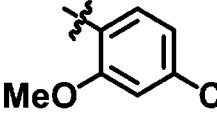
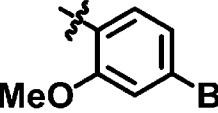
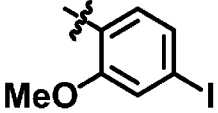
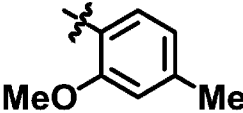
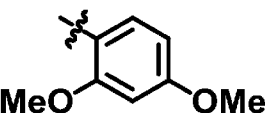
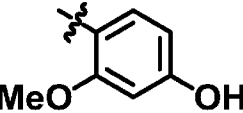
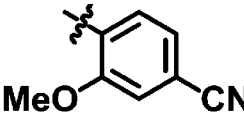
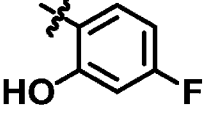
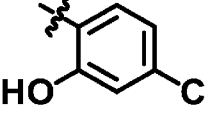
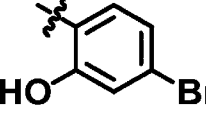
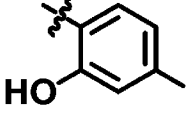
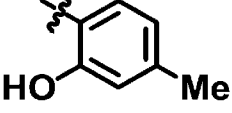
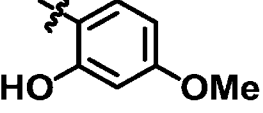
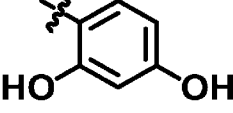
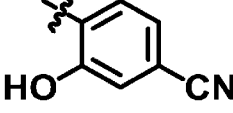
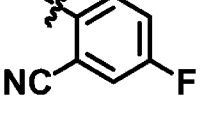
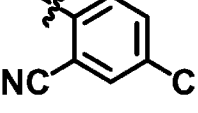
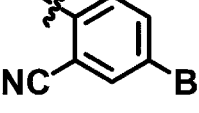
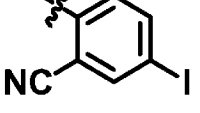
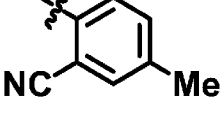
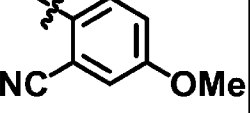
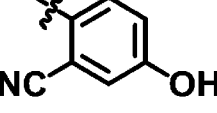
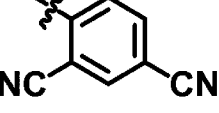
[表2-2]

表 2 の続き

<u>Y-25</u>	<u>Y-26</u>	<u>Y-27</u>	<u>Y-28</u>
			
<u>Y-29</u>	<u>Y-30</u>	<u>Y-31</u>	<u>Y-32</u>
			
<u>Y-33</u>	<u>Y-34</u>	<u>Y-35</u>	<u>Y-36</u>
			
<u>Y-37</u>	<u>Y-38</u>	<u>Y-39</u>	<u>Y-40</u>
			
<u>Y-41</u>	<u>Y-42</u>	<u>Y-43</u>	<u>Y-44</u>
			
<u>Y-45</u>	<u>Y-46</u>	<u>Y-47</u>	<u>Y-48</u>
			

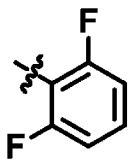
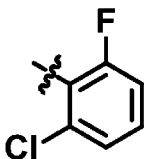
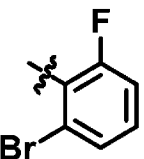
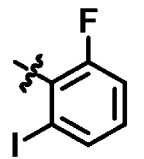
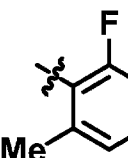
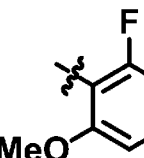
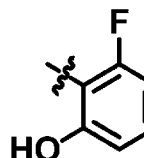
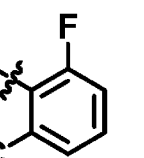
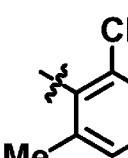
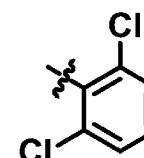
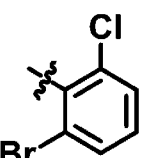
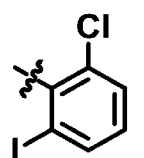
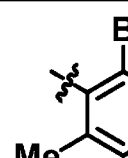
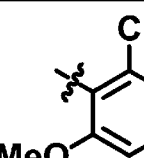
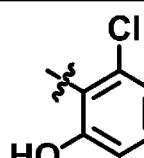
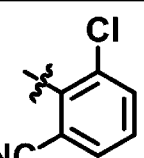
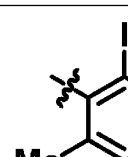
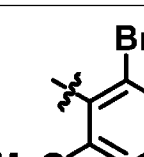
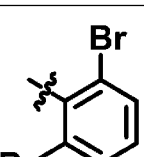
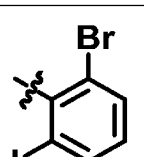
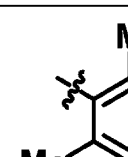
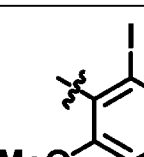
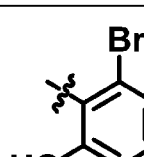
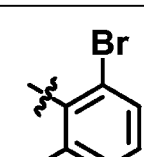
[表2-3]

表 2 の続き

<u>Y-49</u>	<u>Y-50</u>	<u>Y-51</u>	<u>Y-52</u>
			
<u>Y-53</u>	<u>Y-54</u>	<u>Y-55</u>	<u>Y-56</u>
			
<u>Y-57</u>	<u>Y-58</u>	<u>Y-59</u>	<u>Y-60</u>
			
<u>Y-61</u>	<u>Y-62</u>	<u>Y-63</u>	<u>Y-64</u>
			
<u>Y-65</u>	<u>Y-66</u>	<u>Y-67</u>	<u>Y-68</u>
			
<u>Y-69</u>	<u>Y-70</u>	<u>Y-71</u>	<u>Y-72</u>
			

[表2-4]

表 2 の 続 き

<u>Y-73</u>	<u>Y-74</u>	<u>Y-75</u>	<u>Y-76</u>
			
<u>Y-77</u>	<u>Y-78</u>	<u>Y-79</u>	<u>Y-80</u>
			
<u>Y-81</u>	<u>Y-82</u>	<u>Y-83</u>	<u>Y-84</u>
			
<u>Y-85</u>	<u>Y-86</u>	<u>Y-87</u>	<u>Y-88</u>
			
<u>Y-89</u>	<u>Y-90</u>	<u>Y-91</u>	<u>Y-92</u>
			
<u>Y-93</u>	<u>Y-94</u>	<u>Y-95</u>	<u>Y-96</u>
			

[表2-5]

表 2 の続き

<u>Y-97</u>	<u>Y-98</u>	<u>Y-99</u>	<u>Y-100</u>
<u>Y-101</u>	<u>Y-102</u>	<u>Y-103</u>	<u>Y-104</u>
<u>Y-105</u>	<u>Y-106</u>	<u>Y-107</u>	<u>Y-108</u>
<u>Y-109</u>	<u>Y-110</u>	<u>Y-111</u>	<u>Y-112</u>
<u>Y-113</u>	<u>Y-114</u>	<u>Y-115</u>	<u>Y-116</u>
<u>Y-117</u>	<u>Y-118</u>	<u>Y-119</u>	<u>Y-120</u>

[表2-6]

表 2 の続き

Y-121	Y-122	Y-123	Y-124
Y-125	Y-126	Y-127	Y-128
Y-129	Y-130	Y-131	Y-132
Y-133	Y-134	Y-135	Y-136
Y-137	Y-138	Y-139	Y-140
Y-141	Y-142	Y-143	Y-144

[表2-7]

表 2 の続き

Y-145	Y-146	Y-147	Y-148
Y-149	Y-150	Y-151	Y-152
Y-153	Y-154	Y-155	Y-156
Y-157	Y-158	Y-159	Y-160
Y-161	Y-162	Y-163	Y-164
Y-165	Y-166	Y-167	Y-168

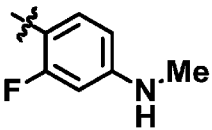
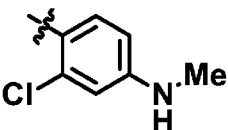
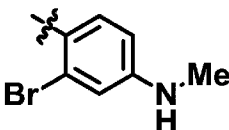
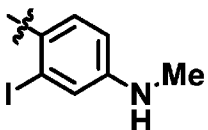
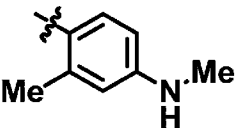
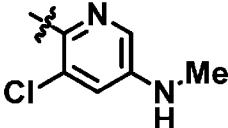
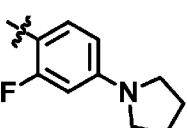
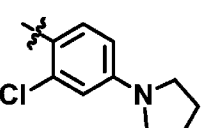
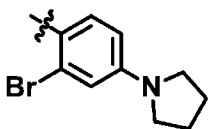
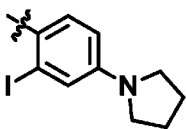
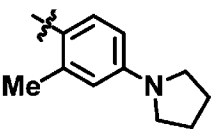
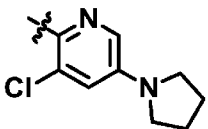
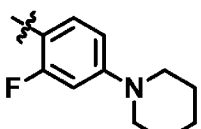
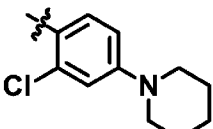
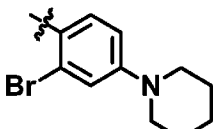
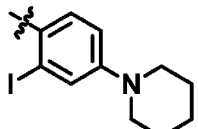
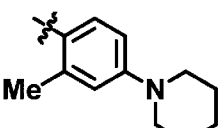
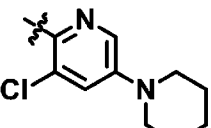
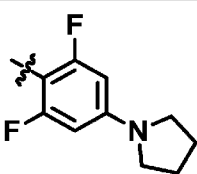
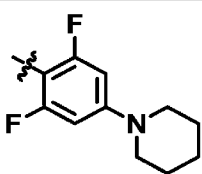
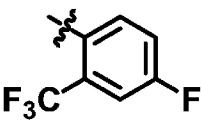
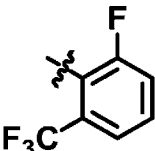
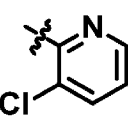
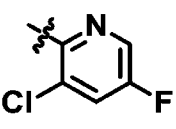
[表2-8]

表 2 の続き

<u>Y-169</u>	<u>Y-170</u>	<u>Y-171</u>	<u>Y-172</u>
<u>Y-173</u>	<u>Y-174</u>	<u>Y-175</u>	<u>Y-176</u>
<u>Y-177</u>	<u>Y-178</u>	<u>Y-179</u>	<u>Y-180</u>
<u>Y-181</u>	<u>Y-182</u>	<u>Y-183</u>	<u>Y-184</u>
<u>Y-185</u>	<u>Y-186</u>	<u>Y-187</u>	<u>Y-188</u>
<u>Y-189</u>	<u>Y-190</u>	<u>Y-191</u>	<u>Y-192</u>

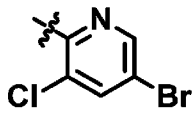
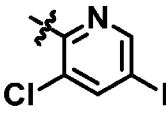
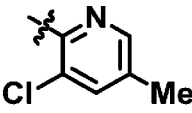
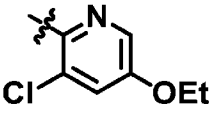
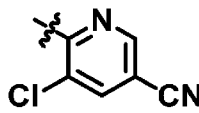
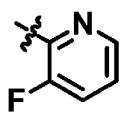
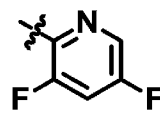
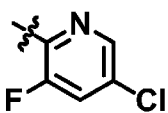
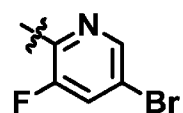
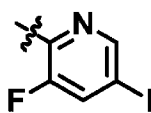
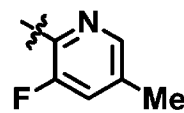
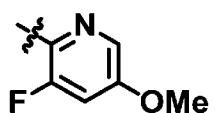
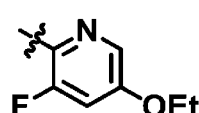
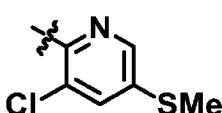
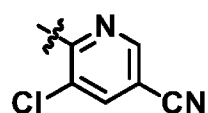
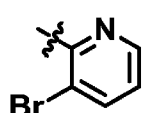
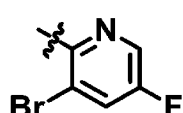
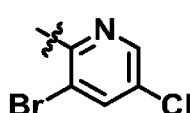
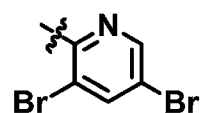
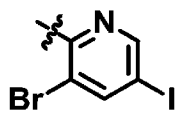
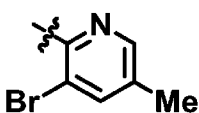
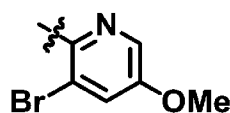
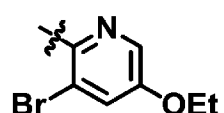
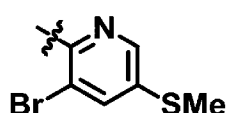
[表2-9]

表 2 の続き

<u>Y-193</u>	<u>Y-194</u>	<u>Y-195</u>	<u>Y-196</u>
			
<u>Y-197</u>	<u>Y-198</u>	<u>Y-199</u>	<u>Y-200</u>
			
<u>Y-201</u>	<u>Y-202</u>	<u>Y-203</u>	<u>Y-204</u>
			
<u>Y-205</u>	<u>Y-206</u>	<u>Y-207</u>	<u>Y-208</u>
			
<u>Y-209</u>	<u>Y-210</u>	<u>Y-211</u>	<u>Y-212</u>
			
<u>Y-213</u>	<u>Y-214</u>	<u>Y-215</u>	<u>Y-216</u>
			

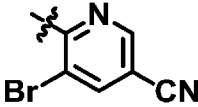
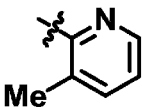
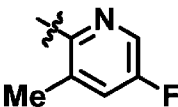
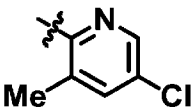
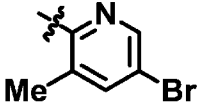
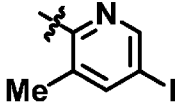
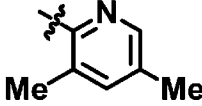
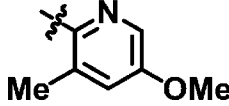
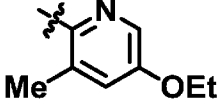
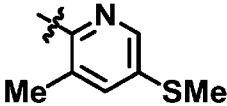
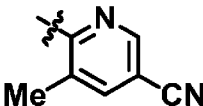
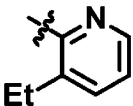
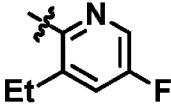
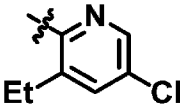
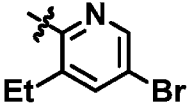
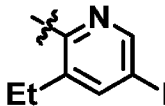
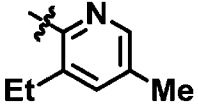
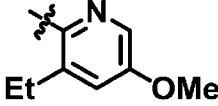
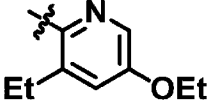
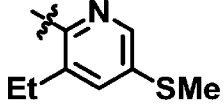
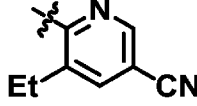
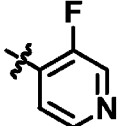
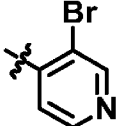
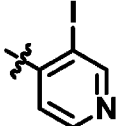
[表2-10]

表 2 の続き

<u>Y-217</u>	<u>Y-218</u>	<u>Y-219</u>	<u>Y-220</u>
			
<u>Y-221</u>	<u>Y-222</u>	<u>Y-223</u>	<u>Y-224</u>
			
<u>Y-225</u>	<u>Y-226</u>	<u>Y-227</u>	<u>Y-228</u>
			
<u>Y-229</u>	<u>Y-230</u>	<u>Y-231</u>	<u>Y-232</u>
			
<u>Y-233</u>	<u>Y-234</u>	<u>Y-235</u>	<u>Y-236</u>
			
<u>Y-237</u>	<u>Y-238</u>	<u>Y-239</u>	<u>Y-240</u>
			

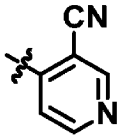
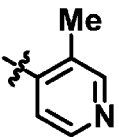
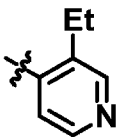
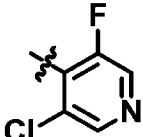
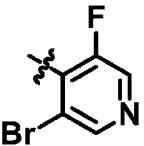
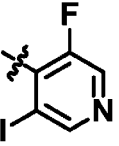
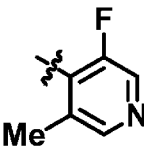
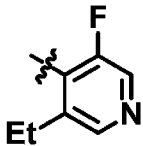
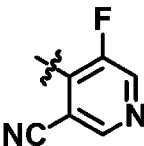
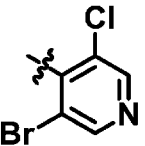
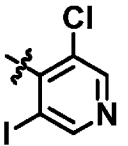
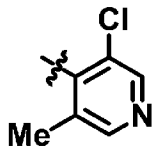
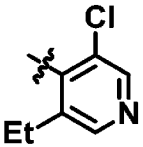
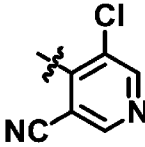
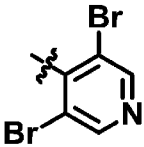
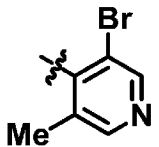
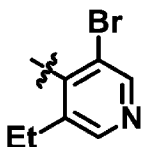
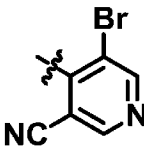
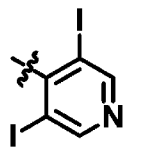
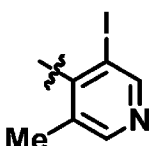
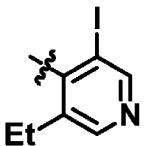
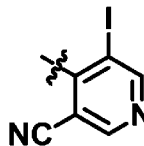
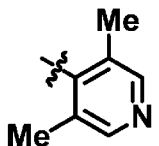
[表2-11]

表 2 の続き

<u>Y-241</u>	<u>Y-242</u>	<u>Y-243</u>	<u>Y-244</u>
			
<u>Y-245</u>	<u>Y-246</u>	<u>Y-247</u>	<u>Y-248</u>
			
<u>Y-249</u>	<u>Y-250</u>	<u>Y-251</u>	<u>Y-252</u>
			
<u>Y-253</u>	<u>Y-254</u>	<u>Y-255</u>	<u>Y-256</u>
			
<u>Y-257</u>	<u>Y-258</u>	<u>Y-259</u>	<u>Y-260</u>
			
<u>Y-261</u>	<u>Y-262</u>	<u>Y-263</u>	<u>Y-264</u>
			

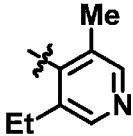
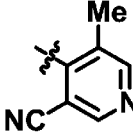
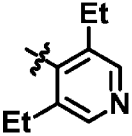
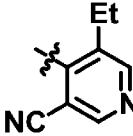
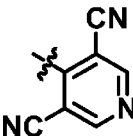
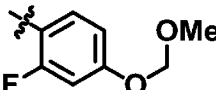
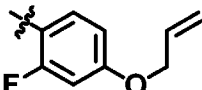
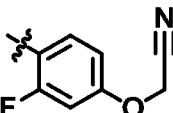
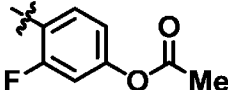
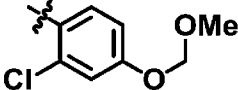
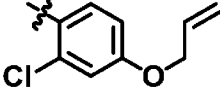
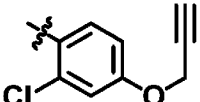
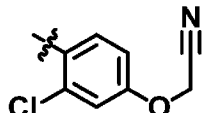
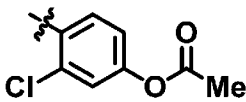
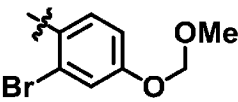
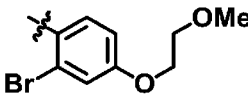
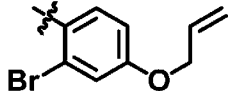
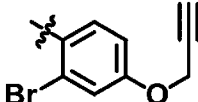
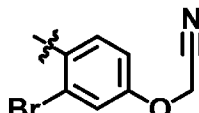
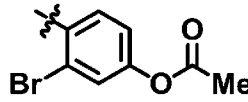
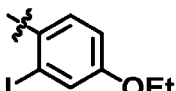
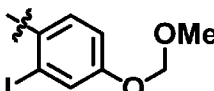
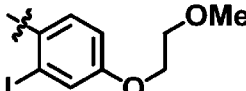
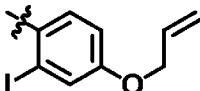
[表2-12]

表 2 の続き

<u>Y-265</u>	<u>Y-266</u>	<u>Y-267</u>	<u>Y-268</u>
			
<u>Y-269</u>	<u>Y-270</u>	<u>Y-271</u>	<u>Y-272</u>
			
<u>Y-273</u>	<u>Y-274</u>	<u>Y-275</u>	<u>Y-276</u>
			
<u>Y-277</u>	<u>Y-278</u>	<u>Y-279</u>	<u>Y-280</u>
			
<u>Y-281</u>	<u>Y-282</u>	<u>Y-283</u>	<u>Y-284</u>
			
<u>Y-285</u>	<u>Y-286</u>	<u>Y-287</u>	<u>Y-288</u>
			

[表2-13]

表 2 の続き

<u>Y-289</u>	<u>Y-290</u>	<u>Y-291</u>	<u>Y-292</u>
			
<u>Y-293</u>	<u>Y-294</u>	<u>Y-295</u>	<u>Y-296</u>
			
<u>Y-297</u>	<u>Y-298</u>	<u>Y-299</u>	<u>Y-300</u>
			
<u>Y-301</u>	<u>Y-302</u>	<u>Y-303</u>	<u>Y-304</u>
			
<u>Y-305</u>	<u>Y-306</u>	<u>Y-307</u>	<u>Y-308</u>
			
<u>Y-309</u>	<u>Y-310</u>	<u>Y-311</u>	<u>Y-312</u>
			

[表2-14]

表 2 の続き

Y-313	Y-314	Y-315	Y-316
Y-317	Y-318	Y-319	Y-320
Y-321	Y-322	Y-323	Y-324
Y-325	Y-326	Y-327	Y-328
Y-329	Y-330	Y-331	Y-332
Y-333	Y-334	Y-335	Y-336

[表2-15]

表 2 の続き

<u>Y-337</u>	<u>Y-338</u>	<u>Y-339</u>	<u>Y-340</u>
<u>Y-341</u>	<u>Y-342</u>	<u>Y-343</u>	<u>Y-344</u>
<u>Y-345</u>	<u>Y-346</u>	<u>Y-347</u>	<u>Y-348</u>
<u>Y-349</u>	<u>Y-350</u>	<u>Y-351</u>	<u>Y-352</u>
<u>Y-353</u>	<u>Y-354</u>	<u>Y-355</u>	<u>Y-356</u>
<u>Y-357</u>	<u>Y-358</u>	<u>Y-359</u>	<u>Y-360</u>

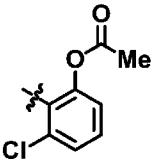
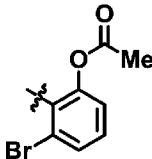
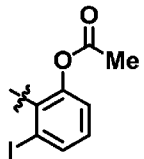
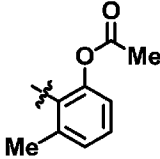
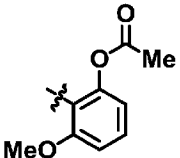
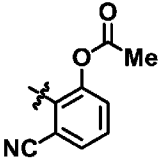
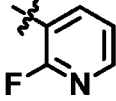
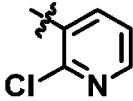
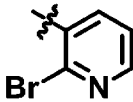
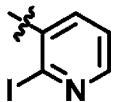
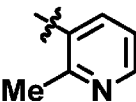
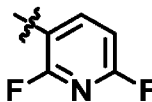
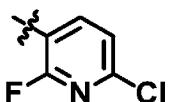
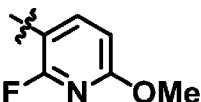
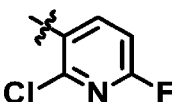
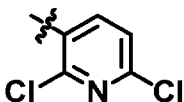
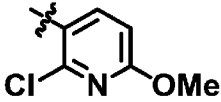
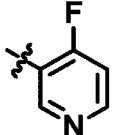
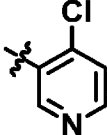
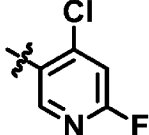
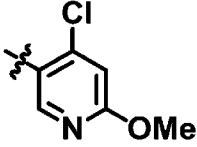
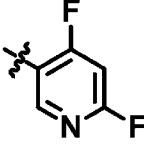
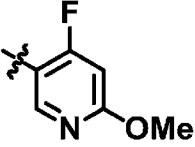
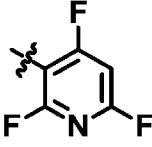
[表2-16]

表 2 の続き

<u>Y-361</u>	<u>Y-362</u>	<u>Y-363</u>	<u>Y-364</u>
<u>Y-365</u>	<u>Y-366</u>	<u>Y-367</u>	<u>Y-368</u>
<u>Y-369</u>	<u>Y-370</u>	<u>Y-371</u>	<u>Y-372</u>
<u>Y-373</u>	<u>Y-374</u>	<u>Y-375</u>	<u>Y-376</u>
<u>Y-377</u>	<u>Y-378</u>	<u>Y-379</u>	<u>Y-380</u>
<u>Y-381</u>	<u>Y-382</u>	<u>Y-383</u>	<u>Y-384</u>

[表2-17]

表 2 の続き

<u>Y-385</u>	<u>Y-386</u>	<u>Y-387</u>	<u>Y-388</u>
			
<u>Y-389</u>	<u>Y-390</u>	<u>Y-391</u>	<u>Y-392</u>
			
<u>Y-393</u>	<u>Y-394</u>	<u>Y-395</u>	<u>Y-396</u>
			
<u>Y-397</u>	<u>Y-398</u>	<u>Y-399</u>	<u>Y-400</u>
			
<u>Y-401</u>	<u>Y-402</u>	<u>Y-403</u>	<u>Y-404</u>
			
<u>Y-405</u>	<u>Y-406</u>	<u>Y-407</u>	<u>Y-408</u>
			

[0387]

[表3-1]

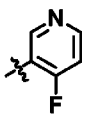
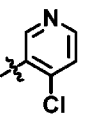
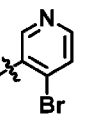
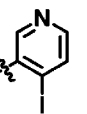
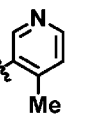
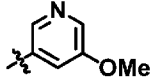
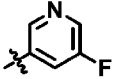
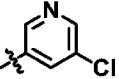
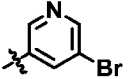
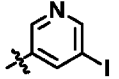
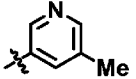
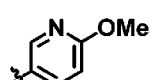
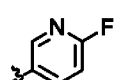
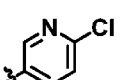
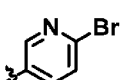
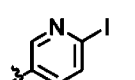
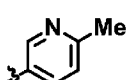
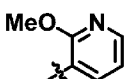
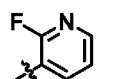
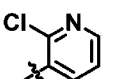
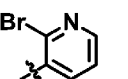
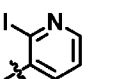
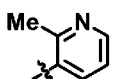
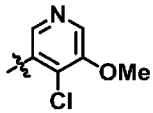
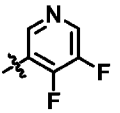
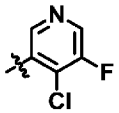
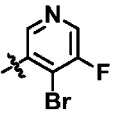
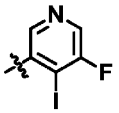
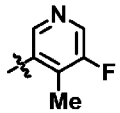
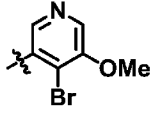
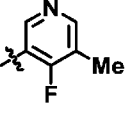
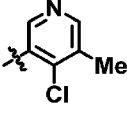
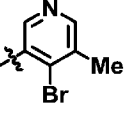
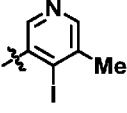
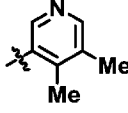
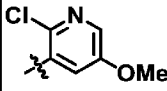
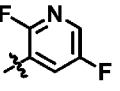
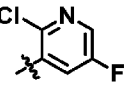
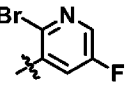
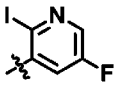
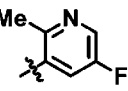
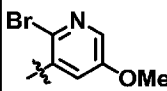
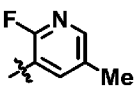
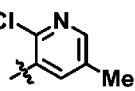
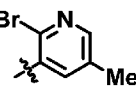
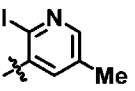
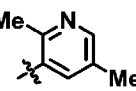
表 3

Het-1	Het-2	Het-3	Het-4	Het-5	Het-6
Het-7	Het-8	Het-9	Het-10	Het-11	Het-12
Het-13	Het-14	Het-15	Het-16	Het-17	Het-18
Het-19	Het-20	Het-21	Het-22	Het-23	Het-24
Het-25	Het-26	Het-27	Het-28	Het-29	Het-30
Het-31	Het-32	Het-33	Het-34	Het-35	Het-36
Het-37	Het-38	Het-39	Het-40	Het-41	Het-42
Het-43	Het-44	Het-45	Het-46	Het-47	Het-48

[0388]

[表3-2]

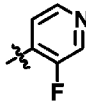
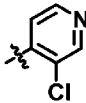
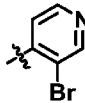
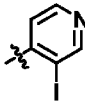
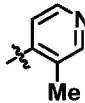
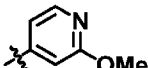
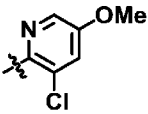
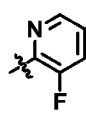
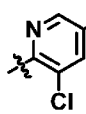
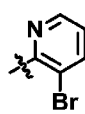
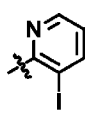
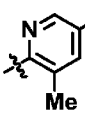
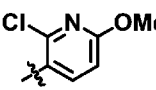
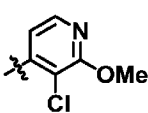
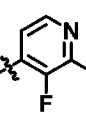
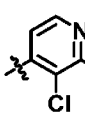
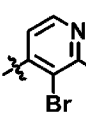
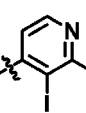
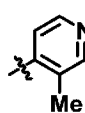
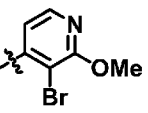
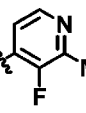
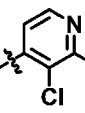
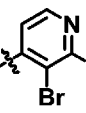
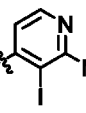
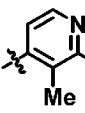
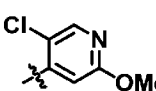
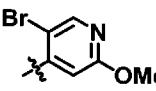
表 3 の続き

Het-49	Het-50	Het-51	Het-52	Het-53	Het-54
					
Het-55	Het-56	Het-57	Het-58	Het-59	Het-60
					
Het-61	Het-62	Het-63	Het-64	Het-65	Het-66
					
Het-67	Het-68	Het-69	Het-70	Het-71	Het-72
					
Het-73	Het-74	Het-75	Het-76	Het-77	Het-78
					
Het-79	Het-80	Het-81	Het-82	Het-83	Het-84
					
Het-85	Het-86	Het-87	Het-88	Het-89	Het-90
					
Het-91	Het-92	Het-93	Het-94	Het-95	Het-96
					

[0389]

[表3-3]

表 3 の続き

Het-97	Het-98	Het-99	Het-100	Het-101	Het-102
					
Het-103	Het-104	Het-105	Het-106	Het-107	Het-108
					
Het-109	Het-110	Het-111	Het-112	Het-113	Het-114
					
Het-115	Het-116	Het-117	Het-118	Het-119	Het-120
					
Het-121	Het-122	Het-123	Het-124	Het-125	Het-126
					
Het-127	Het-128	Het-129	Het-130	Het-131	Het-132
					
Het-133	Het-134	Het-135	Het-136	Het-137	Het-138
					
Het-139	Het-140	Het-141	Het-142	Het-143	Het-144
					

[0390]

[表3-4]

表 3 の続き

Het-145	Het-146	Het-147	Het-148	Het-149	Het-150
Het-151	Het-152	Het-153	Het-154	Het-155	Het-156
Het-157	Het-158	Het-159	Het-160	Het-161	Het-162
Het-163	Het-164	Het-165	Het-166	Het-167	Het-168
Het-169	Het-170	Het-171	Het-172	Het-173	Het-174
Het-175	Het-176	Het-177	Het-178	Het-179	Het-180
Het-181	Het-182	Het-183	Het-184	Het-185	Het-186
Het-187	Het-188	Het-189	Het-190	Het-191	Het-192

[0391]

[表3-5]

表 3 の続き

Het-193	Het-194	Het-195	Het-196	Het-197	Het-198
Het-199	Het-200	Het-201	Het-202	Het-203	Het-204
Het-205	Het-206	Het-207	Het-208	Het-209	Het-210
Het-211	Het-212	Het-213	Het-214	Het-215	Het-216
Het-217	Het-218	Het-219	Het-220	Het-221	Het-222
Het-223	Het-224	Het-225	Het-226	Het-227	Het-228
Het-229	Het-230	Het-231	Het-232	Het-233	Het-234
Het-235	Het-236	Het-237	Het-238	Het-239	Het-240

[0392]

[表3-6]

表 3 の続き

Het-241	Het-242	Het-243	Het-244	Het-245	Het-246
Het-247	Het-248	Het-249	Het-250	Het-251	Het-252
Het-253	Het-254	Het-255	Het-256	Het-257	Het-258
Het-259	Het-260	Het-261	Het-262	Het-263	Het-264
Het-265	Het-266	Het-267	Het-268	Het-269	Het-270
Het-271	Het-272	Het-273	Het-274	Het-275	Het-276
Het-277	Het-278	Het-279	Het-280	Het-281	Het-282
Het-283	Het-284	Het-285	Het-286	Het-287	Het-288

[0393]

[表3-7]

表 3 の続き

Het-289	Het-290	Het-291	Het-292	Het-293	Het-294
Het-295	Het-296	Het-297	Het-298	Het-299	Het-300
Het-301	Het-302	Het-303	Het-304	Het-305	Het-306
Het-307	Het-308	Het-309	Het-310	Het-311	Het-312
Het-313	Het-314	Het-315	Het-316	Het-317	Het-318
Het-319	Het-320	Het-321	Het-322	Het-323	Het-324
Het-325	Het-326	Het-327	Het-328	Het-329	Het-330
Het-331	Het-332	Het-333	Het-334	Het-335	Het-336

[0394]

[表3-8]

表 3 の続き

Het-337	Het-338	Het-339	Het-340	Het-341	Het-342
Het-343	Het-344	Het-345	Het-346	Het-347	Het-348
Het-349	Het-350	Het-351	Het-352	Het-353	Het-354
Het-355	Het-356	Het-357	Het-358	Het-359	Het-360
Het-361	Het-362	Het-363	Het-364	Het-365	Het-366
Het-367	Het-368	Het-369	Het-370	Het-371	Het-372
Het-373	Het-374	Het-375	Het-376	Het-377	Het-378
Het-379	Het-380	Het-381	Het-382	Het-383	Het-384

[0395]

[表3-9]

表 3 の続き

Het-385	Het-386	Het-387	Het-388	Het-389	Het-390
Het-391	Het-392	Het-393	Het-394	Het-395	Het-396
Het-397	Het-398	Het-399	Het-400	Het-401	Het-402
Het-403	Het-404	Het-405	Het-406	Het-407	Het-408
Het-409	Het-410	Het-411	Het-412	Het-413	Het-414
Het-415	Het-416	Het-417	Het-418	Het-419	Het-420
Het-421	Het-422	Het-423	Het-424	Het-425	Het-426
Het-427	Het-428	Het-429	Het-430	Het-431	Het-432

[0396]

[表3-10]

表 3 の続き

Het-433	Het-434	Het-435	Het-436	Het-437	Het-438
Het-439	Het-440	Het-441	Het-442	Het-443	Het-444
Het-445	Het-446	Het-447	Het-448	Het-449	Het-450
Het-451	Het-452	Het-453	Het-454	Het-455	Het-456
Het-457	Het-458	Het-459	Het-460	Het-461	Het-462
Het-463	Het-464	Het-465	Het-466	Het-467	Het-468
Het-469	Het-470	Het-471	Het-472	Het-473	Het-474
Het-475	Het-476	Het-477	Het-478	Het-479	Het-480

[0397]

[表3-11]

表 3 の続き

Het-481	Het-482	Het-483	Het-484	Het-485	Het-486
Het-487	Het-488	Het-489	Het-490	Het-491	Het-492
Het-493	Het-494	Het-495	Het-496	Het-497	Het-498
Het-499	Het-500	Het-501	Het-502	Het-503	Het-504
Het-505	Het-506	Het-507	Het-508	Het-509	Het-510
Het-511	Het-512	Het-513	Het-514	Het-515	Het-516
Het-517	Het-518	Het-519	Het-520	Het-521	Het-522
Het-523	Het-524	Het-525	Het-526	Het-527	Het-528

[表3-12]

表 3 の続き

Het-529	Het-530	Het-531	Het-532	Het-533	Het-534
Het-535	Het-536	Het-537	Het-538	Het-539	Het-540
Het-541	Het-542	Het-543	Het-544	Het-545	Het-546
Het-547	Het-548	Het-549	Het-550	Het-551	Het-552
Het-553	Het-554	Het-555	Het-556	Het-557	Het-558
Het-559	Het-560	Het-561	Het-562	Het-563	Het-564
Het-565	Het-566	Het-567	Het-568	Het-569	Het-570
Het-571	Het-572	Het-573	Het-574	Het-575	Het-576

[0399]

[表3-13]

表 3 の続き

Het-577	Het-578	Het-579	Het-580	Het-581	Het-582
Het-583	Het-584	Het-585	Het-586	Het-587	Het-588
Het-589	Het-590	Het-591	Het-592	Het-593	Het-594
Het-595	Het-596	Het-597	Het-598	Het-599	Het-600
Het-601	Het-602	Het-603	Het-604	Het-605	Het-606
Het-607	Het-608	Het-609	Het-610	Het-611	Het-612
Het-613	Het-614	Het-615	Het-616	Het-617	Het-618
Het-619	Het-620	Het-621	Het-622	Het-623	Het-624

[0400]

[表3-14]

表 3 の続き

Het-625	Het-626	Het-627	Het-628	Het-629	Het-630
Het-631	Het-632	Het-633	Het-634	Het-635	Het-636
Het-637	Het-638	Het-639	Het-640	Het-641	Het-642
Het-643	Het-644	Het-645	Het-646	Het-647	Het-648
Het-649	Het-650	Het-651	Het-652	Het-653	Het-654
Het-655	Het-656	Het-657	Het-658	Het-659	Het-660
Het-661	Het-662	Het-663	Het-664	Het-665	Het-666
Het-667	Het-668	Het-669	Het-670	Het-671	Het-672

[0401]

[表3-15]

表 3 の続き

Het-673	Het-674	Het-675	Het-676	Het-677	Het-678
Het-679	Het-680	Het-681	Het-682	Het-683	Het-684
Het-685	Het-686	Het-687	Het-688	Het-689	Het-690
Het-691	Het-692	Het-693	Het-694	Het-695	Het-696
Het-697	Het-698	Het-699	Het-700	Het-701	Het-702
Het-703	Het-704	Het-705	Het-706	Het-707	Het-708
Het-709	Het-710	Het-711	Het-712	Het-713	Het-714
Het-715	Het-716	Het-717	Het-718	Het-719	Het-720

[0402]

[表3-16]

表 3 の続き

Het-721	Het-722	Het-723	Het-724	Het-725	Het-726
Het-727	Het-728	Het-729	Het-730	Het-731	Het-732
Het-733	Het-734	Het-735	Het-736	Het-737	Het-738
Het-739	Het-740	Het-741	Het-742	Het-743	Het-744
Het-745	Het-746	Het-747	Het-748	Het-749	Het-750
Het-751	Het-752	Het-753	Het-754	Het-755	Het-756
Het-757	Het-758	Het-759	Het-760	Het-761	Het-762
Het-763	Het-764	Het-765	Het-766	Het-767	Het-768

[0403]

[表3-17]

表 3 の続き

Het-769	Het-770	Het-771	Het-772	Het-773	Het-774
Het-775	Het-776	Het-777	Het-778	Het-779	Het-780
Het-781	Het-782	Het-783	Het-784	Het-785	Het-786
Het-787	Het-788	Het-789	Het-790	Het-791	Het-792
Het-793	Het-794	Het-795	Het-796	Het-797	Het-798
Het-799	Het-800	Het-801	Het-802	Het-803	Het-804
Het-805	Het-806	Het-807	Het-808	Het-809	Het-810
Het-811	Het-812	Het-813	Het-814	Het-815	Het-816

[0404]

[表3-18]

表 3 の続き

Het-817	Het-818	Het-819	Het-820	Het-821	Het-822
Het-823	Het-824	Het-825	Het-826	Het-827	Het-828
Het-829	Het-830	Het-831	Het-832	Het-833	Het-834
Het-835	Het-836	Het-837	Het-838	Het-839	Het-840
Het-841	Het-842	Het-843	Het-844	Het-845	Het-846
Het-847	Het-848	Het-849	Het-850	Het-851	Het-852
Het-853	Het-854	Het-855	Het-856	Het-857	Het-858
Het-859	Het-860	Het-861	Het-862	Het-863	Het-864

[0405]

[表3-19]

表 3 の続き

Het-865	Het-866	Het-867	Het-868	Het-869	Het-870
Het-871	Het-872	Het-873	Het-874	Het-875	Het-876
Het-877	Het-878	Het-879	Het-880	Het-881	Het-882
Het-883	Het-884	Het-885	Het-886	Het-887	Het-888
Het-889	Het-890	Het-891	Het-892	Het-893	Het-894
Het-895	Het-896	Het-897	Het-898	Het-899	Het-900
Het-901	Het-902	Het-903	Het-904	Het-905	Het-906
Het-907	Het-908	Het-909	Het-910	Het-911	Het-912

[0406]

[表3-20]

表 3 の続き

Het-913	Het-914	Het-915	Het-916	Het-917	Het-918
Het-919	Het-920	Het-921	Het-922	Het-923	Het-924
Het-925	Het-926	Het-927	Het-928	Het-929	Het-930
Het-931	Het-932	Het-933	Het-934	Het-935	Het-936
Het-937	Het-938	Het-939	Het-940	Het-941	Het-942
Het-943	Het-944	Het-945	Het-946	Het-947	Het-948
Het-949	Het-950	Het-951	Het-952	Het-953	Het-954
Het-955	Het-956	Het-957	Het-958	Het-959	Het-960

[0407]

[表3-21]

表 3 の続き

Het-961	Het-962	Het-963	Het-964	Het-965	Het-966
Het-967	Het-968	Het-969	Het-970	Het-971	Het-972
Het-973	Het-974	Het-975	Het-976	Het-977	Het-978
Het-979	Het-980	Het-981	Het-982	Het-983	Het-984
Het-985	Het-986	Het-987	Het-988	Het-989	Het-990
Het-991	Het-992	Het-993	Het-994	Het-995	Het-996
Het-997	Het-998	Het-999	Het-1000	Het-1001	Het-1002
Het-1003	Het-1004	Het-1005	Het-1006	Het-1007	Het-1008

[0408]

[表3-22]

表 3 の続き

Het-1009	Het-1010	Het-1011	Het-1012	Het-1013	Het-1014
Het-1015	Het-1016	Het-1017	Het-1018	Het-1019	Het-1020
Het-1021	Het-1022	Het-1023	Het-1024	Het-1025	Het-1026
Het-1027	Het-1028	Het-1029	Het-1030	Het-1031	Het-1032
Het-1033	Het-1034	Het-1035	Het-1036	Het-1037	Het-1038
Het-1039	Het-1040	Het-1041	Het-1042	Het-1043	Het-1044
Het-1045	Het-1046	Het-1047	Het-1048	Het-1049	Het-1050
Het-1051	Het-1052	Het-1053	Het-1054	Het-1055	Het-1056

[0409]

[表3-23]

表 3 の続き

Het-1057	Het-1058	Het-1059	Het-1060	Het-1061	Het-1062
Het-1063	Het-1064	Het-1065	Het-1066	Het-1067	Het-1068
Het-1069	Het-1070	Het-1071	Het-1072	Het-1073	Het-1074
Het-1075	Het-1076	Het-1077	Het-1078	Het-1079	Het-1080
Het-1081	Het-1082	Het-1083	Het-1084	Het-1085	Het-1086
Het-1087	Het-1088	Het-1089	Het-1090	Het-1091	Het-1092
Het-1093	Het-1094	Het-1095	Het-1096	Het-1097	Het-1098
Het-1099	Het-1100	Het-1101	Het-1102	Het-1103	Het-1104

[0410]

[表3-24]

表 3 の続き

Het-1105	Het-1106	Het-1107	Het-1108	Het-1109	Het-1110
Het-1111	Het-1112	Het-1113	Het-1114	Het-1115	Het-1116
Het-1117	Het-1118	Het-1119	Het-1120	Het-1121	Het-1122
Het-1123	Het-1124	Het-1125	Het-1126	Het-1127	Het-1128
Het-1129	Het-1130	Het-1131	Het-1132	Het-1133	Het-1134
Het-1135	Het-1136	Het-1137	Het-1138	Het-1139	Het-1140
Het-1141	Het-1142	Het-1143	Het-1144	Het-1145	Het-1146
Het-1147	Het-1148	Het-1149	Het-1150	Het-1151	Het-1152

[0411]

[表3-25]

表 3 の続き

Het-1153	Het-1154	Het-1155	Het-1156	Het-1157	Het-1158
Het-1159	Het-1160	Het-1161	Het-1162	Het-1163	Het-1164
Het-1165	Het-1166	Het-1167	Het-1168	Het-1169	Het-1170
Het-1171	Het-1172	Het-1173	Het-1174	Het-1175	Het-1176
Het-1177	Het-1178	Het-1179	Het-1180	Het-1181	Het-1182
Het-1183	Het-1184	Het-1185	Het-1186	Het-1187	Het-1188
Het-1189	Het-1190	Het-1191	Het-1192	Het-1193	Het-1194
Het-1195	Het-1196	Het-1197	Het-1198	Het-1199	Het-1200

[0412]

[表3-26]

表 3 の続き

Het-1201	Het-1202	Het-1203	Het-1204	Het-1205	Het-1206
Het-1207	Het-1208	Het-1209	Het-1210	Het-1211	Het-1212
Het-1213	Het-1214	Het-1215	Het-1216	Het-1217	Het-1218
Het-1219	Het-1220	Het-1221	Het-1222	Het-1223	Het-1224
Het-1225	Het-1226	Het-1227	Het-1228	Het-1229	Het-1230
Het-1231	Het-1232	Het-1233	Het-1234	Het-1235	Het-1236
Het-1237	Het-1238	Het-1239	Het-1240	Het-1241	Het-1242
Het-1243	Het-1244	Het-1245	Het-1246	Het-1247	Het-1248

[0413]

[表3-27]

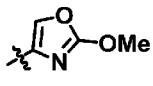
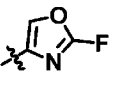
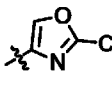
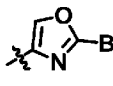
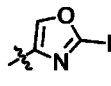
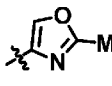
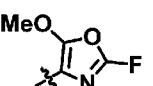
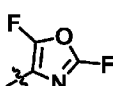
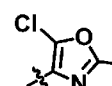
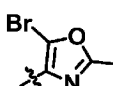
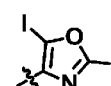
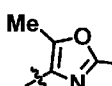
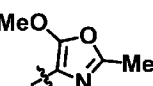
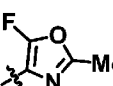
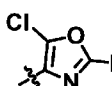
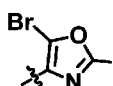
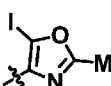
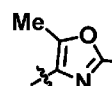
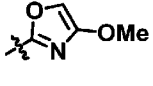
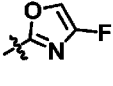
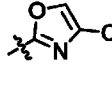
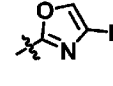
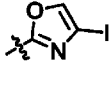
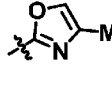
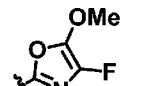
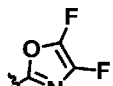
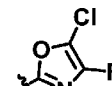
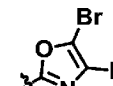
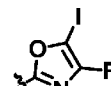
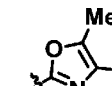
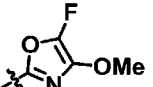
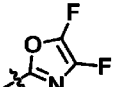
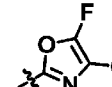
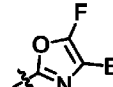
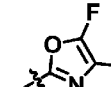
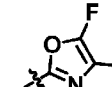
表 3 の続き

Het-1249	Het-1250	Het-1251	Het-1252	Het-1253	Het-1254
Het-1255	Het-1256	Het-1257	Het-1258	Het-1259	Het-1260
Het-1261	Het-1262	Het-1263	Het-1264	Het-1265	Het-1266
Het-1267	Het-1268	Het-1269	Het-1270	Het-1271	Het-1272
Het-1273	Het-1274	Het-1275	Het-1276	Het-1277	Het-1278
Het-1279	Het-1280	Het-1281	Het-1282	Het-1283	Het-1284
Het-1285	Het-1286	Het-1287	Het-1288	Het-1289	Het-1290
Het-1291	Het-1292	Het-1293	Het-1294	Het-1295	Het-1296

[0414]

[表3-28]

表 3 の続き

Het-1297	Het-1298	Het-1299	Het-1300	Het-1301	Het-1302
					
Het-1303	Het-1304	Het-1305	Het-1306	Het-1307	Het-1308
					
Het-1309	Het-1310	Het-1311	Het-1312	Het-1313	Het-1314
					
Het-1315	Het-1316	Het-1317	Het-1318	Het-1319	Het-1320
					
Het-1321	Het-1322	Het-1323	Het-1324	Het-1325	Het-1326
					
Het-1327	Het-1328	Het-1329	Het-1330	Het-1331	Het-1332
					
Het-1333	Het-1334	Het-1335	Het-1336	Het-1337	Het-1338
					
Het-1339	Het-1340	Het-1341	Het-1342	Het-1343	Het-1344
					

[表3-29]

表 3 の続き

Het-1345	Het-1346	Het-1347	Het-1348	Het-1349	Het-1350
Het-1351	Het-1352	Het-1353	Het-1354	Het-1355	Het-1356
Het-1357	Het-1358	Het-1359	Het-1360	Het-1361	Het-1362
Het-1363	Het-1364	Het-1365	Het-1366	Het-1367	Het-1368
Het-1369	Het-1370	Het-1371	Het-1372	Het-1373	Het-1374
Het-1375	Het-1376	Het-1377	Het-1378	Het-1379	Het-1380
Het-1381	Het-1382	Het-1383	Het-1384	Het-1385	Het-1386
Het-1387	Het-1388	Het-1389	Het-1390	Het-1391	Het-1392

[0416]

[表3-30]

表3の続き

Het-1393	Het-1394	Het-1395	Het-1396	Het-1397	Het-1398
Het-1399	Het-1400	Het-1401	Het-1402	Het-1403	Het-1404
Het-1405	Het-1406	Het-1407	Het-1408	Het-1409	Het-1410
Het-1411	Het-1412	Het-1413	Het-1414	Het-1415	Het-1416
Het-1417	Het-1418	Het-1419	Het-1420	Het-1421	Het-1422
Het-1423	Het-1424	Het-1425	Het-1426	Het-1427	Het-1428
Het-1429	Het-1430	Het-1431	Het-1432	Het-1433	Het-1434
Het-1435	Het-1436	Het-1437	Het-1438	Het-1439	Het-1440

[表3-31]

表3の続き

Het-1441	Het-1442	Het-1443	Het-1444	Het-1445	Het-1446
Het-1447	Het-1448	Het-1449	Het-1450	Het-1451	Het-1452
Het-1453	Het-1454	Het-1455	Het-1456	Het-1457	Het-1458
Het-1459	Het-1460	Het-1461	Het-1462	Het-1463	Het-1464
Het-1465	Het-1466	Het-1467	Het-1468	Het-1469	Het-1470
Het-1471	Het-1472	Het-1473	Het-1474	Het-1475	Het-1476
Het-1477	Het-1478	Het-1479	Het-1480	Het-1481	Het-1482
Het-1483	Het-1484	Het-1485	Het-1486	Het-1487	Het-1488

[表3-32]

表3の続き

Het-1489	Het-1490	Het-1491	Het-1492	Het-1493	Het-1494
Het-1495	Het-1496	Het-1497	Het-1498	Het-1499	Het-1500
Het-1501	Het-1502	Het-1503	Het-1504	Het-1505	Het-1506
Het-1507	Het-1508	Het-1509	Het-1510	Het-1511	Het-1512
Het-1513	Het-1514	Het-1515	Het-1516	Het-1517	Het-1518
Het-1519	Het-1520	Het-1521	Het-1522	Het-1523	Het-1524
Het-1525	Het-1526	Het-1527	Het-1528	Het-1529	Het-1530
Het-1531	Het-1532	Het-1533	Het-1534	Het-1535	Het-1536

[表3-33]

表3の続き

Het-1537	Het-1538	Het-1539	Het-1540	Het-1541	Het-1542
Het-1543	Het-1544	Het-1545	Het-1546	Het-1547	Het-1548
Het-1549	Het-1550	Het-1551	Het-1552	Het-1553	Het-1554
Het-1555	Het-1556	Het-1557	Het-1558	Het-1559	Het-1560
Het-1561	Het-1562	Het-1563	Het-1564	Het-1565	Het-1566
Het-1567	Het-1568	Het-1569	Het-1570	Het-1571	Het-1572
Het-1573	Het-1574	Het-1575	Het-1576	Het-1577	Het-1578
Het-1579	Het-1580	Het-1581	Het-1582	Het-1583	Het-1584

[表3-34]

表3の続き

Het-1585	Het-1586	Het-1587	Het-1588	Het-1589	Het-1590
Het-1591	Het-1592	Het-1593	Het-1594	Het-1595	Het-1596
Het-1597	Het-1598	Het-1599	Het-1600	Het-1601	Het-1602
Het-1603	Het-1604	Het-1605	Het-1606	Het-1607	Het-1608
Het-1609	Het-1610	Het-1611	Het-1612	Het-1613	Het-1614
Het-1615	Het-1616	Het-1617	Het-1618	Het-1619	Het-1620
Het-1621	Het-1622	Het-1623	Het-1624	Het-1625	Het-1626
Het-1627	Het-1628	Het-1629	Het-1630	Het-1631	Het-1632

[表3-35]

表3の続き

Het-1633	Het-1634	Het-1635	Het-1636	Het-1637	Het-1638
Het-1639	Het-1640	Het-1641	Het-1642	Het-1643	Het-1644
Het-1645	Het-1646	Het-1647	Het-1648	Het-1649	Het-1650
Het-1651	Het-1652	Het-1653	Het-1654	Het-1655	Het-1656
Het-1657	Het-1658	Het-1659	Het-1660	Het-1661	Het-1662
Het-1663	Het-1664	Het-1665	Het-1666	Het-1667	Het-1668
Het-1669	Het-1670	Het-1671	Het-1672	Het-1673	Het-1674
Het-1675	Het-1676	Het-1677	Het-1678	Het-1679	Het-1680

[表3-36]

表3の続き

Het-1681	Het-1682	Het-1683	Het-1684	Het-1685	Het-1686
Het-1687	Het-1688	Het-1689	Het-1690	Het-1691	Het-1692
Het-1693	Het-1694	Het-1695	Het-1696	Het-1697	Het-1698
Het-1699	Het-1700	Het-1701	Het-1702	Het-1703	Het-1704
Het-1705	Het-1706	Het-1707	Het-1708	Het-1709	Het-1710
Het-1711	Het-1712	Het-1713	Het-1714	Het-1715	Het-1716
Het-1717	Het-1718	Het-1719	Het-1720	Het-1721	Het-1722
Het-1723	Het-1724	Het-1725	Het-1726	Het-1727	Het-1728

[表3-37]

表3の続き

Het-1729	Het-1730	Het-1731	Het-1732	Het-1733	Het-1734
Het-1735	Het-1736	Het-1737	Het-1738	Het-1739	Het-1740
Het-1741	Het-1742	Het-1743	Het-1744	Het-1745	Het-1746
Het-1747	Het-1748	Het-1749	Het-1750	Het-1751	Het-1752
Het-1753	Het-1754	Het-1755	Het-1756	Het-1757	Het-1758
Het-1759	Het-1760	Het-1761	Het-1762	Het-1763	Het-1764
Het-1765	Het-1766	Het-1767	Het-1768	Het-1769	Het-1770
Het-1771	Het-1772	Het-1773	Het-1774	Het-1775	Het-1776

[表3-38]

表3の続き

Het-1777	Het-1778	Het-1779	Het-1780	Het-1781	Het-1782
Het-1783	Het-1784	Het-1785	Het-1786	Het-1787	Het-1788
Het-1789	Het-1790	Het-1791	Het-1792	Het-1793	Het-1794
Het-1795	Het-1796	Het-1797	Het-1798	Het-1799	Het-1800
Het-1801	Het-1802	Het-1803	Het-1804	Het-1805	Het-1806
Het-1807	Het-1808	Het-1809	Het-1810	Het-1811	Het-1812
Het-1813	Het-1814	Het-1815	Het-1816	Het-1817	Het-1818
Het-1819	Het-1820	Het-1821	Het-1822	Het-1823	Het-1824

[表3-39]

表3の続き

Het-1825	Het-1826	Het-1827	Het-1828	Het-1829	Het-1830
Het-1831	Het-1832	Het-1833	Het-1834	Het-1835	Het-1836
Het-1837	Het-1838	Het-1839	Het-1840	Het-1841	Het-1842
Het-1843	Het-1844	Het-1845	Het-1846	Het-1847	Het-1848
Het-1849	Het-1850	Het-1851	Het-1852	Het-1853	Het-1854
Het-1855	Het-1856	Het-1857	Het-1858	Het-1859	Het-1860
Het-1861	Het-1862	Het-1863	Het-1864	Het-1865	Het-1866
Het-1867	Het-1868	Het-1869	Het-1870	Het-1871	Het-1872

[表3-40]

表3の続き

Het-1873	Het-1874	Het-1875	Het-1876	Het-1877	Het-1878
Het-1879	Het-1880	Het-1881	Het-1882	Het-1883	Het-1884
Het-1885	Het-1886	Het-1887	Het-1888	Het-1889	Het-1890
Het-1891	Het-1892	Het-1893	Het-1894	Het-1895	Het-1896
Het-1897	Het-1898	Het-1899	Het-1900	Het-1901	Het-1902
Het-1903	Het-1904	Het-1905	Het-1906	Het-1907	Het-1908
Het-1909	Het-1910	Het-1911	Het-1912	Het-1913	Het-1914
Het-1915	Het-1916	Het-1917	Het-1918	Het-1919	Het-1920

[表3-41]

表3の続き

Het-1921	Het-1922	Het-1923	Het-1924	Het-1925	Het-1926
Het-1927	Het-1928	Het-1929	Het-1930	Het-1931	Het-1932
Het-1933	Het-1934	Het-1935	Het-1936	Het-1937	Het-1938
Het-1939	Het-1940	Het-1941	Het-1942	Het-1943	Het-1944
Het-1945	Het-1946	Het-1947	Het-1948	Het-1949	Het-1950
Het-1951	Het-1952	Het-1953	Het-1954	Het-1955	Het-1956
Het-1957	Het-1958	Het-1959	Het-1960	Het-1961	Het-1962
Het-1963	Het-1964	Het-1965	Het-1966	Het-1967	Het-1968

[表3-42]

表3の続き

Het-1969	Het-1970	Het-1971	Het-1972	Het-1973	Het-1974
Het-1975	Het-1976	Het-1977	Het-1978	Het-1979	Het-1980
Het-1981	Het-1982	Het-1983	Het-1984	Het-1985	Het-1986
Het-1987	Het-1988	Het-1989	Het-1990	Het-1991	Het-1992
Het-1993	Het-1994	Het-1995	Het-1996	Het-1997	Het-1998
Het-1999	Het-2000	Het-2001	Het-2002	Het-2003	Het-2004
Het-2005	Het-2006	Het-2007	Het-2008	Het-2009	Het-2010
Het-2011	Het-2012	Het-2013	Het-2014	Het-2015	Het-2016

[表3-43]

表3の続き

Het-2017	Het-2018	Het-2019	Het-2020	Het-2021	Het-2022
Het-2023	Het-2024	Het-2025	Het-2026	Het-2027	Het-2028
Het-2029	Het-2030	Het-2031	Het-2032	Het-2033	Het-2034
Het-2035	Het-2036	Het-2037	Het-2038	Het-2039	Het-2040
Het-2041	Het-2042	Het-2043	Het-2044	Het-2045	Het-2046
Het-2047	Het-2048	Het-2049	Het-2050	Het-2051	Het-2052
Het-2053	Het-2054	Het-2055	Het-2056	Het-2057	Het-2058
Het-2059	Het-2060	Het-2061	Het-2062	Het-2063	Het-2064

[表3-44]

表3の続き

Het-2065	Het-2066	Het-2067	Het-2068	Het-2069	Het-2070
Het-2071	Het-2072	Het-2073	Het-2074	Het-2075	Het-2076
Het-2077	Het-2078	Het-2079	Het-2080	Het-2081	Het-2082
Het-2083	Het-2084	Het-2085	Het-2086	Het-2087	Het-2088
Het-2089	Het-2090	Het-2091	Het-2092	Het-2093	Het-2094
Het-2095	Het-2096	Het-2097	Het-2098	Het-2099	Het-2100
Het-2101	Het-2102	Het-2103	Het-2104	Het-2105	Het-2106
Het-2107	Het-2108	Het-2109	Het-2110	Het-2111	Het-2112

[表3-45]

表3の続き

Het-2113	Het-2114	Het-2115	Het-2116	Het-2117	Het-2118
Het-2119	Het-2120	Het-2121	Het-2122	Het-2123	Het-2124
Het-2125	Het-2126	Het-2127	Het-2128	Het-2129	Het-2130
Het-2131	Het-2132	Het-2133	Het-2134	Het-2135	Het-2136
Het-2137	Het-2138	Het-2139	Het-2140	Het-2141	Het-2142
Het-2143	Het-2144	Het-2145	Het-2146	Het-2147	Het-2148
Het-2149	Het-2150	Het-2151	Het-2152	Het-2153	Het-2154
Het-2155	Het-2156	Het-2157	Het-2158	Het-2159	Het-2160

[表3-46]

表3の続き

Het-2161	Het-2162	Het-2163	Het-2164	Het-2165	Het-2166
Het-2167	Het-2168	Het-2169	Het-2170	Het-2171	Het-2172
Het-2173	Het-2174	Het-2175	Het-2176	Het-2177	Het-2178
Het-2179	Het-2180	Het-2181	Het-2182	Het-2183	Het-2184
Het-2185	Het-2186	Het-2187	Het-2188	Het-2189	Het-2190
Het-2191	Het-2192	Het-2193	Het-2194	Het-2195	Het-2196
Het-2197	Het-2198	Het-2199	Het-2200	Het-2201	Het-2202
Het-2203	Het-2204	Het-2205	Het-2206	Het-2207	Het-2208

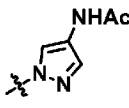
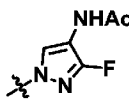
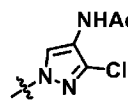
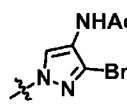
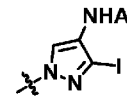
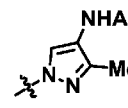
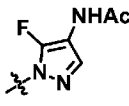
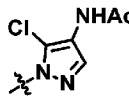
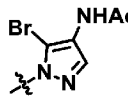
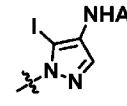
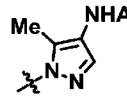
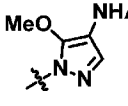
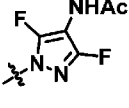
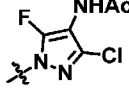
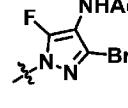
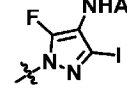
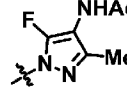
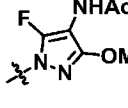
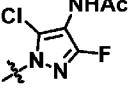
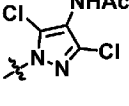
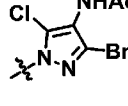
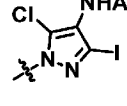
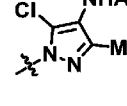
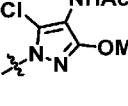
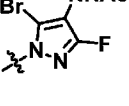
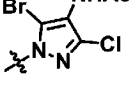
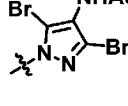
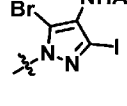
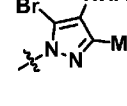
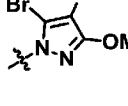
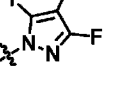
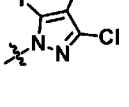
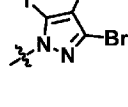
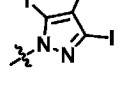
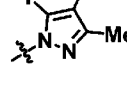
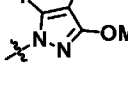
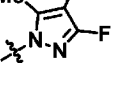
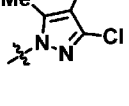
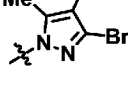
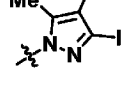
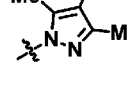
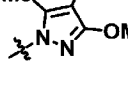
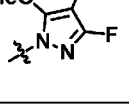
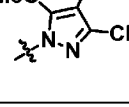
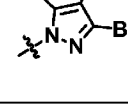
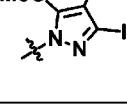
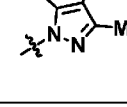
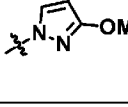
[表3-47]

表3の続き

Het-2209	Het-2210	Het-2211	Het-2212	Het-2213	Het-2214
Het-2215	Het-2216	Het-2217	Het-2218	Het-2219	Het-2220
Het-2221	Het-2222	Het-2223	Het-2224	Het-2225	Het-2226
Het-2227	Het-2228	Het-2229	Het-2230	Het-2231	Het-2232
Het-2233	Het-2234	Het-2235	Het-2236	Het-2237	Het-2238
Het-2239	Het-2240	Het-2241	Het-2242	Het-2243	Het-2244
Het-2245	Het-2246	Het-2247	Het-2248	Het-2249	Het-2250
Het-2251	Het-2252	Het-2253	Het-2254	Het-2255	Het-2256

[表3-48]

表3の続き

Het-2257	Het-2258	Het-2259	Het-2260	Het-2261	Het-2262
					
Het-2263	Het-2264	Het-2265	Het-2266	Het-2267	Het-2268
					
Het-2269	Het-2270	Het-2271	Het-2272	Het-2273	Het-2274
					
Het-2275	Het-2276	Het-2277	Het-2278	Het-2279	Het-2280
					
Het-2281	Het-2282	Het-2283	Het-2284	Het-2285	Het-2286
					
Het-2287	Het-2288	Het-2289	Het-2290	Het-2291	Het-2292
					
Het-2293	Het-2294	Het-2295	Het-2296	Het-2297	Het-2298
					
Het-2299	Het-2300	Het-2301	Het-2302	Het-2303	Het-2304
					

[表3-49]

表3の続き

Het-2305	Het-2306	Het-2307	Het-2308	Het-2309	Het-2310
Het-2311	Het-2312	Het-2313	Het-2314	Het-2315	Het-2316
Het-2317	Het-2318	Het-2319	Het-2320	Het-2321	Het-2322
Het-2323	Het-2324	Het-2325	Het-2326	Het-2327	Het-2328
Het-2329	Het-2330	Het-2331	Het-2332	Het-2333	Het-2334
Het-2335	Het-2336	Het-2337	Het-2338	Het-2339	Het-2340
Het-2341	Het-2342	Het-2343	Het-2344	Het-2345	Het-2346
Het-2347	Het-2348	Het-2349	Het-2350	Het-2351	Het-2352

[表3-50]

表3の続き

Het-2353	Het-2354	Het-2355	Het-2356	Het-2357	Het-2358
Het-2359	Het-2360	Het-2361	Het-2362	Het-2363	Het-2364
Het-2365	Het-2366	Het-2367	Het-2368	Het-2369	Het-2370
Het-2371	Het-2372	Het-2373	Het-2374	Het-2375	Het-2376
Het-2377	Het-2378	Het-2379	Het-2380	Het-2381	Het-2382
Het-2383	Het-2384	Het-2385	Het-2386	Het-2387	Het-2388
Het-2389	Het-2390	Het-2391	Het-2392	Het-2393	Het-2394
Het-2395	Het-2396	Het-2397	Het-2398	Het-2399	Het-2400

[表3-51]

表3の続き

Het-2401	Het-2402	Het-2403	Het-2404	Het-2405	Het-2406
Het-2407	Het-2408	Het-2409	Het-2410	Het-2411	Het-2412
Het-2413	Het-2414	Het-2415	Het-2416	Het-2417	Het-2418
Het-2419	Het-2420	Het-2421	Het-2422	Het-2423	Het-2424
Het-2425	Het-2426	Het-2427	Het-2428	Het-2429	Het-2430
Het-2431	Het-2432	Het-2433	Het-2434	Het-2435	Het-2436
Het-2437	Het-2438	Het-2439	Het-2440	Het-2441	Het-2442
Het-2443	Het-2444	Het-2445	Het-2446	Het-2447	Het-2448

[表3-52]

表3の続き

Het-2449	Het-2450	Het-2451	Het-2452	Het-2453	Het-2454
Het-2455	Het-2456	Het-2457	Het-2458	Het-2459	Het-2460
Het-2461	Het-2462	Het-2463	Het-2464	Het-2465	Het-2466
Het-2467	Het-2468	Het-2469	Het-2470	Het-2471	Het-2472
Het-2473	Het-2474	Het-2475	Het-2476	Het-2477	Het-2478
Het-2479	Het-2480	Het-2481	Het-2482	Het-2483	Het-2484
Het-2485	Het-2486	Het-2487	Het-2488	Het-2489	Het-2490
Het-2491	Het-2492	Het-2493	Het-2494	Het-2495	Het-2496

[表3-53]

表3の続き

Het-2497	Het-2498	Het-2499	Het-2500	Het-2501	Het-2502
Het-2503	Het-2504	Het-2505	Het-2506	Het-2507	Het-2508
Het-2509	Het-2510	Het-2511	Het-2512	Het-2513	Het-2514
Het-2515	Het-2516	Het-2517	Het-2518	Het-2519	Het-2520
Het-2521	Het-2522	Het-2523	Het-2524	Het-2525	Het-2526
Het-2527	Het-2528	Het-2529	Het-2530	Het-2531	Het-2532
Het-2533	Het-2534	Het-2535	Het-2536	Het-2537	Het-2538
Het-2539	Het-2540	Het-2541	Het-2542	Het-2543	Het-2544

[表3-54]

表3の続き

Het-2545	Het-2546	Het-2547	Het-2548	Het-2549	Het-2550
Het-2551	Het-2552	Het-2553	Het-2554	Het-2555	Het-2556
Het-2557	Het-2558	Het-2559	Het-2560	Het-2561	Het-2562
Het-2563	Het-2564	Het-2565	Het-2566	Het-2567	Het-2568
Het-2569	Het-2570	Het-2571	Het-2572	Het-2573	Het-2574
Het-2575	Het-2576	Het-2577	Het-2578	Het-2579	Het-2580
Het-2581	Het-2582	Het-2583	Het-2584	Het-2585	Het-2586
Het-2587	Het-2588	Het-2589	Het-2590	Het-2591	Het-2592

[表3-55]

表3の続き

Het-2593	Het-2594	Het-2595	Het-2596	Het-2597	Het-2598
Het-2599	Het-2600	Het-2601	Het-2602	Het-2603	Het-2604
Het-2605	Het-2606	Het-2607	Het-2608	Het-2609	Het-2610
Het-2611	Het-2612	Het-2613	Het-2614	Het-2615	Het-2616
Het-2617	Het-2618	Het-2619	Het-2620	Het-2621	Het-2622
Het-2623	Het-2624	Het-2625	Het-2626	Het-2627	Het-2628
Het-2629	Het-2630	Het-2631	Het-2632	Het-2633	Het-2634
Het-2635	Het-2636	Het-2637	Het-2638	Het-2639	Het-2640

[表3-56]

表3の続き

Het-2641	Het-2642	Het-2643	Het-2644	Het-2645	Het-2646
Het-2647	Het-2648	Het-2649	Het-2650	Het-2651	Het-2652
Het-2653	Het-2654	Het-2655	Het-2656	Het-2657	Het-2658
Het-2659	Het-2660	Het-2661	Het-2662	Het-2663	Het-2664
Het-2665	Het-2666	Het-2667	Het-2668	Het-2669	Het-2670
Het-2671	Het-2672	Het-2673	Het-2674	Het-2675	Het-2676
Het-2677	Het-2678	Het-2679	Het-2680	Het-2681	Het-2682
Het-2683	Het-2684	Het-2685	Het-2686	Het-2687	Het-2688

[表3-57]

表3の続き

Het-2689	Het-2690	Het-2691	Het-2692	Het-2693	Het-2694
Het-2695	Het-2696	Het-2697	Het-2698	Het-2699	Het-2700
Het-2701	Het-2702	Het-2703	Het-2704	Het-2705	Het-2706
Het-2707	Het-2708	Het-2709	Het-2710	Het-2711	Het-2712
Het-2713	Het-2714	Het-2715	Het-2716	Het-2717	Het-2718
Het-2719	Het-2720	Het-2721	Het-2722	Het-2723	Het-2724
Het-2725	Het-2726	Het-2727	Het-2728	Het-2729	Het-2730
Het-2731	Het-2732	Het-2733	Het-2734	Het-2735	Het-2736

[表3-58]

表3の続き

Het-2737	Het-2738	Het-2739	Het-2740	Het-2741	Het-2742
Het-2743	Het-2744	Het-2745	Het-2746	Het-2747	Het-2748
Het-2749	Het-2750	Het-2751	Het-2752	Het-2753	Het-2754
Het-2755	Het-2756	Het-2757	Het-2758	Het-2759	Het-2760
Het-2761	Het-2762	Het-2763	Het-2764	Het-2765	Het-2766
Het-2767	Het-2768	Het-2769	Het-2770	Het-2771	Het-2772
Het-2773	Het-2774	Het-2775	Het-2776	Het-2777	Het-2778
Het-2779	Het-2780	Het-2781	Het-2782	Het-2783	Het-2784

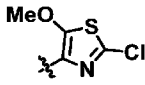
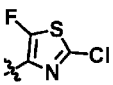
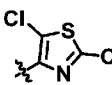
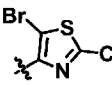
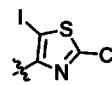
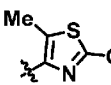
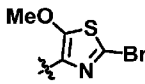
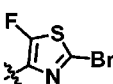
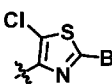
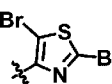
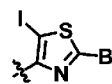
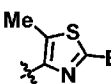
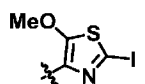
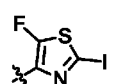
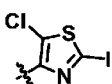
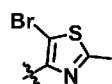
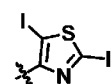
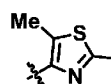
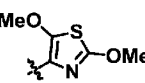
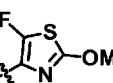
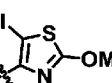
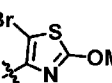
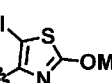
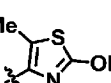
[表3-59]

表3の続き

Het-2785	Het-2786	Het-2787	Het-2788	Het-2789	Het-2790
Het-2791	Het-2792	Het-2793	Het-2794	Het-2795	Het-2796
Het-2797	Het-2798	Het-2799	Het-2800	Het-2801	Het-2802
Het-2803	Het-2804	Het-2805	Het-2806	Het-2807	Het-2808
Het-2809	Het-2810	Het-2811	Het-2812	Het-2813	Het-2814
Het-2815	Het-2816	Het-2817	Het-2818	Het-2819	Het-2820
Het-2821	Het-2822	Het-2823	Het-2824	Het-2825	Het-2826
Het-2827	Het-2828	Het-2829	Het-2830	Het-2831	Het-2832

[表3-60]

表3の続き

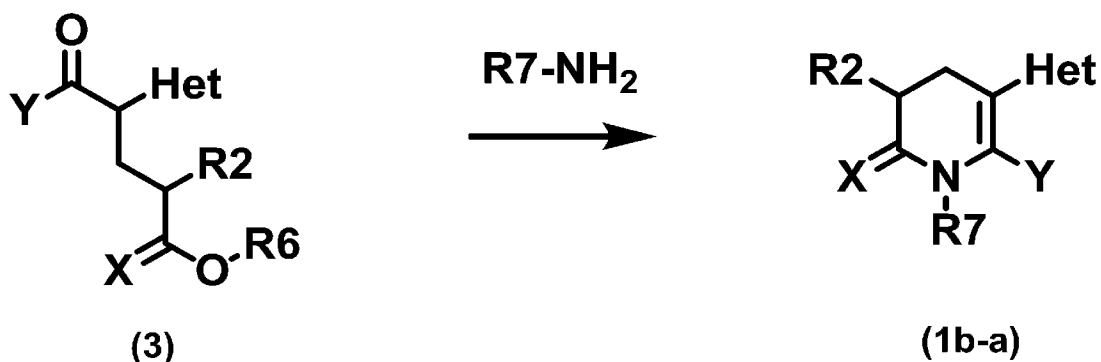
Het-2833	Het-2834	Het-2835	Het-2836	Het-2837	Het-2838
					
Het-2839	Het-2840	Het-2841	Het-2842	Het-2843	Het-2844
					
Het-2845	Het-2846	Het-2847	Het-2848	Het-2849	Het-2850
					
Het-2851	Het-2852	Het-2853	Het-2854	Het-2855	Het-2856
					
Het-2857	Het-2858	Het-2859	Het-2860	Het-2861	Het-2862
					
Het-2863	Het-2864	Het-2865	Het-2866	Het-2867	Het-2868
					
Het-2869	Het-2870	Het-2871	Het-2872	Het-2873	Het-2874
					
Het-2875	Het-2876	Het-2877	Het-2878	Het-2879	Het-2880
					

[0447] 以下に、式（1）で表される化合物の製造方法を例示する。本発明化合物

の製造方法は、製造方法 A ～製造方法 A J に限定されるものではない。

[0448] [製造方法 A]

[化83]



[0449] 式中、R 7 は、水素原子、水酸基、シアノ基、置換基 A で適宜置換されてもよい C 1 ～C 6 のアルキル基、C 1 ～C 6 のハロアルキル基、置換基 A で適宜置換されてもよい C 3 ～C 8 のシクロアルキル基、置換基 A で適宜置換されてもよい C 2 ～C 6 のアルケニル基、C 2 ～C 6 のハロアルケニル基、置換基 A で適宜置換されてもよい C 2 ～C 6 のアルキニル基、C 2 ～C 6 のハロアルキニル基、置換基 A で適宜置換されてもよい C 1 ～C 6 のアルコキシ基、C 1 ～C 6 のハロアルコキシ基、置換基 A で適宜置換されてもよい C 3 ～C 8 のシクロアルコキシ基、置換基 A で適宜置換されてもよい C 2 ～C 6 のアルケニルオキシ基、C 2 ～C 6 のハロアルケニルオキシ基、置換基 A で適宜置換されてもよい C 3 ～C 6 のアルキニルオキシ基、C 3 ～C 6 のハロアルキニルオキシ基、または R a R b N-（ここで、R a および R b は、それぞれ独立して、水素原子、置換基 B で適宜置換されてもよい C 1 ～C 6 のアルキル基、C 1 ～C 6 のハロアルキル基、または C 3 ～C 8 のシクロアルキル基を表すか、あるいは R a および R b は、結合する窒素原子と一緒に、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、またはアゾカニル基を形成するものを表す。）を表し、R 6 は、水素原子、または C 1 ～C 6 のアルキル基を表し、R 2、Het、X、および Y は前記と同義である。

[0450] 製造方法 A は、本発明化合物および本発明化合物の製造中間体を含む式（

1 b - a) で表される化合物を得る方法であって、式 (3) で表される化合物と R_7NH_2 とを、酸存在下で反応させることを含む製造方法である。

[0451] 本反応に使用する R_7NH_2 は、市販品として入手または公知の方法で製造することができる。 R_7NH_2 は、塩酸、酢酸のような酸性化合物との塩を形成したものでもよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはない。

[0452] 本反応に使用する R_7NH_2 は、式 (3) で表される化合物に対して 1 当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、好ましくは、1 当量以上 200 当量以下である。

[0453] 本反応に使用する酸として、塩酸、硫酸等の無機酸類や、酢酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等の有機酸類が例示され、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定することはないが、好ましくは、酢酸である。また、 R_7NH_2 と酸性化合物との塩を使用する際には、酸の使用は必須ではない。

[0454] 本反応に使用する酸の量は、 R_7NH_2 に対して 1 当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、好ましくは、1 当量以上 200 当量以下である。また、使用する酸が液体である場合には、溶媒として使用することも可能である。

[0455] 本反応には溶媒を使用することができるが、必ずしも必須ではない。

[0456] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、酢酸、メタンスルホン酸等の酸性系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル tert-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、アセトニトリル等のニトリル系溶媒、N-メチルピロリドン、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒

、 1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等のウレア系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。溶媒として、好ましくは、酸性系溶媒が挙げられ、さらに好ましくは、酢酸が挙げられる。

[0457] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(3)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0458] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、50℃以上180℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0459] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル-tert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

[0460] 前記で得られた式(1b-a)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができる。

が、必須ではない。

[0461] 前記で得られた式 (1 b - a) で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0462] 溶媒留去後に得られた式 (1 b - a) で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0463] 製造方法 A によると、式 (1 b - a) で表される化合物において R 7 が水素原子を表すときに製造することができる式 (2) で表される化合物は、本発明化合物のうち、式 (1 b) で表される化合物を得る有用な製造中間体となりうる。

[0464] 式 (2) で表される製造中間体の具体例は、表 4 に示す構造式 (1 - 1 ~ 1 - 12) と、表 2 に示す Y と、表 3 に示す H e t と、酸素原子または硫黄原子である X との組み合わせによって表される。これらの化合物は、例示のためのものであり、本発明はこれらに限定されるものではない。

[0465]

[表4]

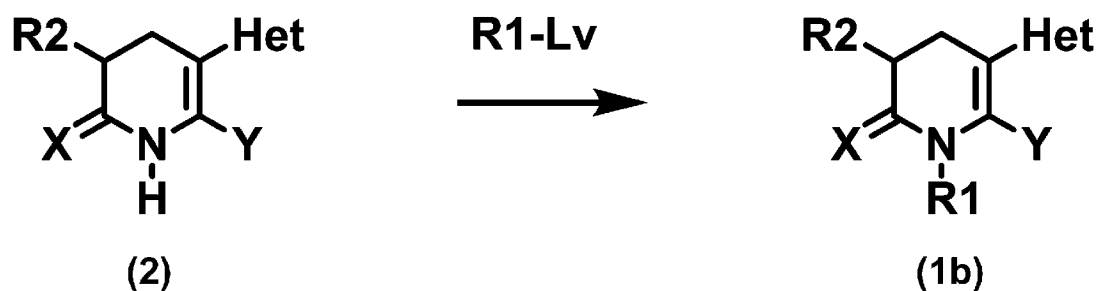
表 4

I-1	I-2	I-3
I-4	I-5	I-6
I-7	I-8	I-9
I-10	I-11	I-12

[0466] この式（2）で表される化合物を製造中間体として利用し、本発明の式（1 b）を得る方法を説明する。

[0467] [製造方法 B]

[化84]



- [0468] 式中、 L_v はメタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、*p*-トルエンスルホニル基、ハロゲン原子等の脱離基を表し、 R_1 、 R_2 、 Het 、 X および Y は、前記と同義である。
- [0469] 製造方法Bは、式(1b)で表される化合物を得る方法であって、式(2)で表される製造中間体と R_1-L_v とを、塩基の存在下、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。
- [0470] 本反応に使用する R_1-L_v は、市販品として入手または公知の方法で製造することができる。
- [0471] 本反応に使用する R_1-L_v の量は、式(2)で表される化合物に対して1当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、1当量以上10当量以下である。
- [0472] 本反応に使用する塩基として、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、水素化ナトリウム等の無機塩基類が例示されるが、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはない。
- [0473] 本反応に使用する塩基の量は、式(2)で表される化合物に対して1当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、1当量以上10当量以下である。
- [0474] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、アセトニトリル等のニトリル系溶媒、*N*-メチルピロリドン、*N,N*-ジメチルホルムアミド、*N,N*-ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等のウレア系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四

塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の硫黄系溶媒、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0475] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(2)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0476] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、0℃以上150℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0477] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

[0478] 前記で得られた式(1b)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、

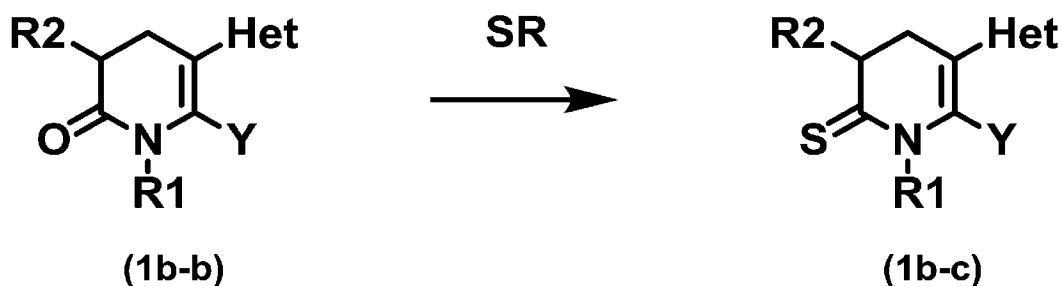
必須ではない。

[0479] 前記で得られた式(1b)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0480] 溶媒留去後に得られた式(1b)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0481] [製造方法C]

[化85]



[0482] 式中、SRは硫黄化剤を表し、R1、R2、Het、およびYは、前記と同義である。

[0483] 製造方法Cは、式(1b)で表される化合物のうち、式(1b-c)で表される化合物を得る製造方法であって、式(1b-b)で表される化合物と硫黄化剤(SR)とを、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0484] 本反応に使用する硫黄化剤としては、ローソン試薬(2,4-ビス(4-メトキシフェニル)-1,3-ジチア-2,4-ジホスフェタン-2,4-ジスルフィド)等が挙げられる。

[0485] 本反応に使用する硫黄化剤の量は、式(1b-b)で表される化合物に対して0.5当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、好ましくは、1当量以上10当量以下である。

[0486] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、ク

ロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0487] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(1b-b)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0488] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、50℃以上180℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0489] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水、もしくは適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。また、本反応においては、分液操作は必須ではない。

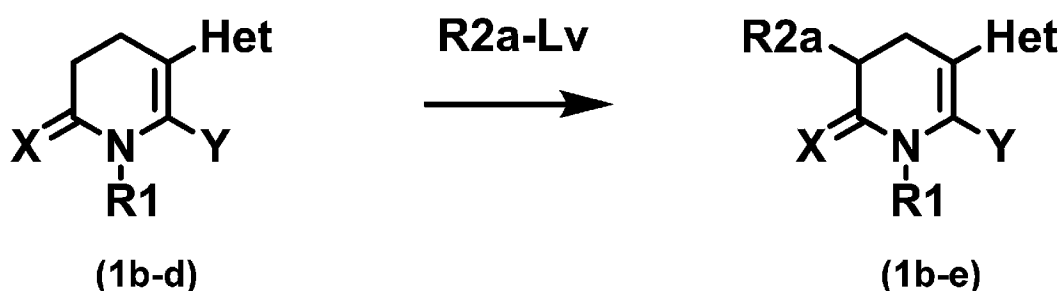
[0490] 前記で得られた式(1b-c)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0491] 前記で得られた式(1b-c)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0492] 溶媒留去後に得られた式(1b-c)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0493] [製造方法D]

[化86]



[0494] 式中、R2aは、置換基Aで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC3～C8のシクロアルキル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC2～C6のアルケニル基、C2～C6のハロアルケニル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC2～C6のアルキニル基、またはC2～C6のハロアルキニル基を表し、R1、Het、Lv、XおよびYは、前記と同義である。

[0495] 製造方法Dは、式(1b)で表される化合物のうち、R2aが置換基Aで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC3～C8のシクロアルキル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC2～C6のアルケニル基、C2～C6のハロアルケニル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC2～C6のアルキニル基、またはC2～C6のハロアルキニル基である式(1b-e)で表される化合物の合成方法であって、式(1b-d)で表される化合物とR2a-Lvとを、塩基の存在下、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0496] 本反応に使用するR2a-Lvは、市販品として入手または公知の方法で

製造することができる。

[0497] 本反応に使用する R^2a-Lv の量は、式 (1b-d) で表される化合物に対して 1 当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、1 当量以上 1.8 当量以下である。

[0498] 本反応に使用する塩基として、水素化ナトリウム等の金属ヒドリド類、メチルリチウム、ブチルリチウム、sec-ブチルリチウム、t-ブチルリチウム、ヘキシルリチウム等の有機リチウム類や、リチウムジイソプロピルアミド、ヘキサメチルジシラザンリチウム、ヘキサメチルジシラザンナトリウム、ヘキサメチルジシラザンカリウム等の金属アミド類が例示される。

[0499] 本反応に使用する塩基の量は、式 (1b-d) で表される化合物に対して 1 当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、1 当量以上 10 当量以下である。

[0500] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル-t-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または 2 種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0501] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式 (1b-d) で表される化合物に対して 3 重量倍以上 200 重量倍以下である。

[0502] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、 -80°C 以上 100°C 以下または溶媒の沸点以下である。

[0503] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合

は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

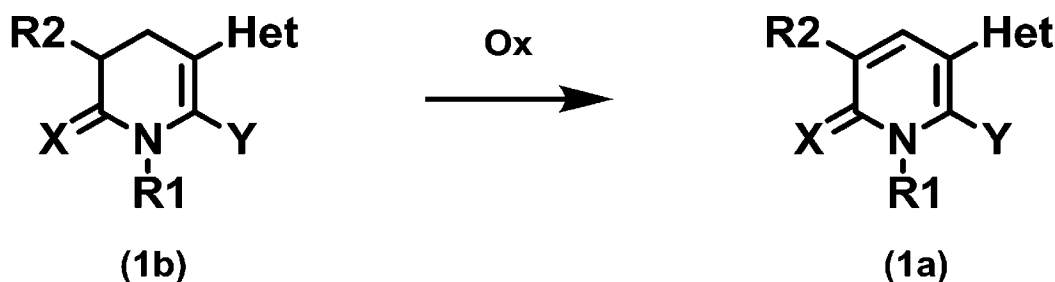
[0504] 前記で得られた式(1b-e)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0505] 前記で得られた式(1b-e)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0506] 溶媒留去後に得られた式(1b-e)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0507] [製造方法E]

[化87]



[0508] 式中、Oxは酸化剤を表し、R1、R2、Het、XおよびYは、前記と同義である。

[0509] 製造方法Eは、式(1a)で表される化合物を得る方法であって、式(1b)で表される化合物と酸化剤(Ox)とを、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0510] 本反応に使用する酸化剤としては、二酸化マンガン等の金属酸化物類、2,3-ジクロロ-5,6-ジシアノ-p-ベンゾキノン等のベンゾキノン類、アゾビスイソブチロニトリル、2,2'-アゾビス(4-メトキシ-2,4-ジメチルバレロニトリル)、過酸化ベンゾイル等のラジカル開始剤とN-クロロスクシンイミド、N-ブロモスクシンイミド、N-ヨードスクシンイミド、1,3-ジクロロ-5,5-ジメチルヒダントイン、1,3-ジブromo-5,5-ジメチルヒダントイン、1,3-ジヨード-5,5-ジメチルヒダントイン等のハロゲン化剤を組み合わせたもの等を使用することができる。

[0511] 以下、酸化剤が金属酸化物類である方法について説明する。

[0512] 本反応に使用する酸化剤の量は、式(1b)に表される化合物に対して1当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、1当量以上200当量以下である。

[0513] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒等が挙げられる。

。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0514] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(1b)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0515] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、0℃以上150℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0516] 反応の後処理としては、溶解していない金属類を濾過することにより除去することが可能である。さらに、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。また、本反応において、分液操作は必須ではない。

[0517] 前記で得られた式(1a)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

- [0518] 前記で得られた式（１ a）で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。
- [0519] 溶媒留去後に得られた式（１ a）で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。
- [0520] 以下、酸化剤がベンゾキノン類である方法について説明する。
- [0521] 本反応に使用する酸化剤の量は、式（１ b）で表される化合物に対して１当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、１当量以上２０当量以下である。
- [0522] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または２種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。
- [0523] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式（１ b）で表される化合物に対して３重量倍以上２００重量倍以下である。
- [0524] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、０℃以上１５０℃以下または溶媒の沸点以下である。
- [0525] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エ

チル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル-*t*-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。また、本反応において、分液操作は必須ではない。

[0526] 前記で得られた式(1a)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0527] 前記で得られた式(1a)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0528] 溶媒留去後に得られた式(1a)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0529] 以下、酸化剤がラジカル開始剤とハロゲン化剤との組み合わせである方法について説明する。

[0530] 本反応に使用するラジカル開始剤とハロゲン化剤の量は、それぞれ、式(1b)で表される化合物に対して0.01当量以上と1.0当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはない。好ましくは、ラジカル開始剤が0.01当量以上1当量以下であり、ハロゲン化剤が1当量以上3当量以下である。

[0531] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化ベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等の

ハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0532] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(1b)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0533] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、20℃以上150℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0534] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

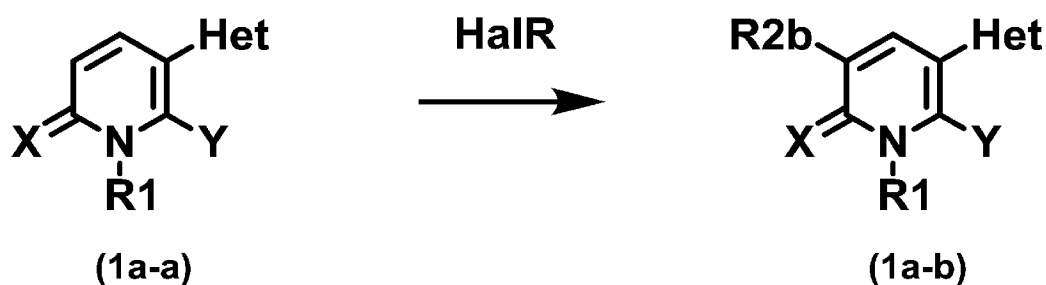
[0535] 前記で得られた式(1a)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0536] 前記で得られた式(1a)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0537] 溶媒留去後に得られた式(1a)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0538] [製造方法F]

[化88]



[0539] 式中、R2bはハロゲン原子を表し、HalRはハロゲン化剤を表し、R1、Het、XおよびYは前記と同義である。

[0540] 製造方法Fは、式(1a)で表される化合物のうち、R2bがハロゲン原子を表す式(1a-b)で表される化合物を得る製造方法であって、式(1a-a)で表される化合物とハロゲン化剤(HalR)とを、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0541] 本反応に使用するハロゲン化剤としては、セレクトロフルオル(N-フルオロ-N'-トリエチレンジアミンビス(テトラフルオロボラート))、N-クロロスクシンイミド、N-ブロモスクシンイミド、N-ヨードスクシンイミド、1,3-ジクロロ-5,5-ジメチルヒダントイン、1,3-ジブロモ-5,5-ジメチルヒダントイン、1,3-ジヨード-5,5-ジメチルヒダントイン、臭素、ヨウ素等が挙げられる。

[0542] 本反応に使用するハロゲン化剤の量は、式(1a-a)で表される化合物に対して1当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、1当量以上10当量以下である。ただし、ヒダントインを含むハロゲン化剤の量は、0.5当量以上あれば、目的

とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはなく、好ましくは、1当量以上5当量以下である。

[0543] 本反応に使用するハロゲン化剤がヨウ素化剤である場合、塩酸、硫酸等の無機酸類や、酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸等の有機酸のような酸を加えることができる。

[0544] 本反応に使用するハロゲン化剤がヨウ素化剤である場合に使用する酸の量は、式(1a-a)で表される化合物に対して0.01当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、0.1当量以上3当量以下である。

[0545] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、硫酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸等の酸性系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル tert-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、アセトニトリル等のニトリル系溶媒、N-メチルピロリドン、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等のウレア系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0546] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(1a-a)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0547] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、0℃以上150℃以下または溶媒の沸点以下

である。

[0548] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

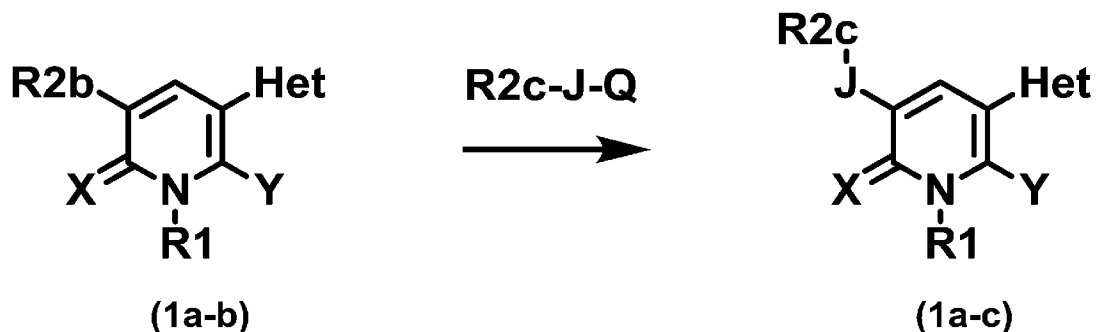
[0549] 前記で得られた式(1a-b)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0550] 前記で得られた式(1a-b)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0551] 溶媒留去後に得られた式(1a-b)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0552] [製造方法G]

[化89]



[0553] 式中、Jは酸素原子または硫黄原子を表し、Jが酸素原子の場合、R2cは置換基Aで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC3～C8のシクロアルキル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC2～C6のアルケニル基、C2～C6のハロアルケニル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC3～C6のアルキニル基、またはC3～C6のハロアルキニル基を表し、Jが硫黄原子の場合、R2cはC1～C6のアルキル基またはC1～C6のハロアルキル基を表し、Qは水素原子または金属を表し、R1、Het、R2b、XおよびYは前記と同義である。

[0554] 製造方法Gは、式(1a)で表される化合物のうち、Jは酸素原子または硫黄原子を表し、Jが酸素原子の場合、R2cが置換基Aで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC3～C8のシクロアルキル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC2～C6のアルケニル基、C2～C6のハロアルケニル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC3～C6のアルキニル基、またはC3～C6のハロアルキニル基を表し、Jが硫黄原子の場合、R2cはC1～C6のアルキル基またはC1～C6のハロアルキル基を表す式(1a-c)で表される化合物の合成法であって、式(1a-b)で表される化合物とR2c-J-Qとを、遷移金属類および塩基の存在下、溶媒中で反応させるカップリング反応によって得ることを含む製造方法である。

[0555] 式(1a-b)で表される化合物中、好ましいR2bは、塩素原子、臭素

原子、またはヨウ素原子である。

[0556] 本反応に使用する R_2C-J-Q は、市販品として入手または公知の方法で製造できる。好ましい Q は、水素原子、または、ナトリウム、カリウム等のアルカリ金属類である。

[0557] 本反応に使用する R_2C-J-Q の量は、式 (1 a - b) で表される化合物に対して 1 当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはない。 Q が水素原子のときは、溶媒としても使用可能である。

[0558] 本反応に使用する遷移金属類は、配位子を有してよく、酢酸パラジウム、[1, 1' - ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン] パラジウムジクロリド、トリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム、ビス (トリフェニルホスフィン) パラジウムジクロリド等のパラジウム類等である。

[0559] 本反応に使用する遷移金属類の量は、式 (1 a - b) で表される化合物に対して 0.001 当量以上 1 当量以下であるが、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはない。

[0560] 本反応を効率的に進行させるために、トリフェニルホスフィン、1, 1' - ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン、2 - ジシクロヘキシルホスフィノー 2' 4' 6' - トリイソプロピルビフェニル、2 - ジ *t* - ブチルホスフィノー 2' 4' 6' - トリイソプロピルビフェニル等のホスフィン配位子を添加することができる。

[0561] 本反応に使用するホスフィン配位子の量は、式 (1 a - b) で表される化合物に対して 0.001 当量以上 1 当量以下であるが、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはない。

[0562] 本反応に使用する塩基は、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムのような無機塩基類やトリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基類等である。

[0563] 本反応に使用する塩基の量は、式 (1 a - b) で表される化合物に対して

1 当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、好ましくは、1 当量以上 50 当量以下である。

[0564] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、 R_2C-J-H （式中、 R_2C は前記と同義であり、 J は酸素原子である。）で表されるアルコール溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル-*t*-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0565] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式（1a-b）で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0566] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、30℃以上200℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0567] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル-*t*-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可

能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。また、濾過操作を行うことにより、不溶物を除去することも可能であるが必須ではない。

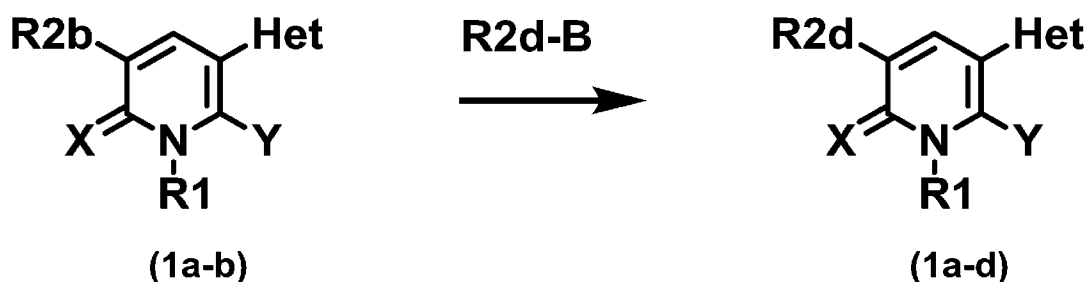
[0568] 前記で得られた式(1a-c)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0569] 前記で得られた式(1a-c)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0570] 溶媒留去後に得られた式(1a-c)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0571] [製造方法H]

[化90]



[0572] 式中、R2dは置換基Aで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC3～C8のシクロアルキル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC2～C6のアルケニル基、またはC2～C6のハロアルケニル基を表し、R2d-Bは有機ボロン酸類を表し、R1、Het、R2b、XおよびYは前記と同義である。

[0573] 製造方法Hは、式(1a)で表される化合物のうち、R2dが置換基Aで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル

基、置換基Aで適宜置換されてもよいC₃～C₈のシクロアルキル基、置換基Aで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルケニル基、またはC₂～C₆のハロアルケニル基である式(1a-d)で表される化合物の合成方法であって、式(1a-b)で表される化合物と有機ボロン酸類(R₂d-B)とを、遷移金属類および塩基の存在下、溶媒中で反応させる鈴木-宮浦カップリングによって得ることを含む製造方法である。

[0574] 式(1a-b)中、好ましいR₂bは、塩素原子、臭素原子、またはヨウ素原子である。

[0575] 本反応に使用するR₂d-Bは、有機ボロン酸や有機ボロン酸エステル等の有機ボロン酸類を表し、市販品として入手または公知の方法で製造できる。

[0576] 本反応に使用するR₂d-Bの量は、式(1a-b)で表される化合物に対して、1当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、好ましくは、1当量以上10当量以下である。

[0577] 本反応に使用する遷移金属類は、パラジウム、ニッケル、ルテニウム等であり、配位子を有してよい。好ましくは、酢酸パラジウム、[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]パラジウムジクロリド、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウムジクロリド等のパラジウム類が挙げられる。

[0578] 本反応に使用する遷移金属類の量は、式(1a-b)で表される化合物に対して0.001当量以上1当量以下であるが、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはない。

[0579] 本反応を効率的に進行させるために、トリフェニルホスフィン、トリシクロヘキシルホスフィン等のホスフィン配位子を添加することができる。

[0580] 本反応に使用するホスフィン配位子の量は、式(1a-b)で表される化合物に対して0.001当量以上1当量以下であるが、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはない。

- [0581] 本反応に使用する塩基は、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、リン酸三カリウムのような無機塩基類やナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム *t*-ブトキシド等の金属アルコキシド類等である。
- [0582] 本反応に使用する塩基の量は、式（1 a - b）で表される化合物に対して 1 当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、好ましくは、1 当量以上 50 当量以下である。
- [0583] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、水溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル *t*-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または 2 種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。
- [0584] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式（1 a - b）で表される化合物に対して 3 重量倍以上 200 重量倍以下である。
- [0585] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、30℃以上 200℃以下または溶媒の沸点以下である。
- [0586] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテ

ル、ジイソプロピルエーテル、メチル-tert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。また、濾過操作を行うことにより、不溶物を除去することも可能であるが必須ではない。

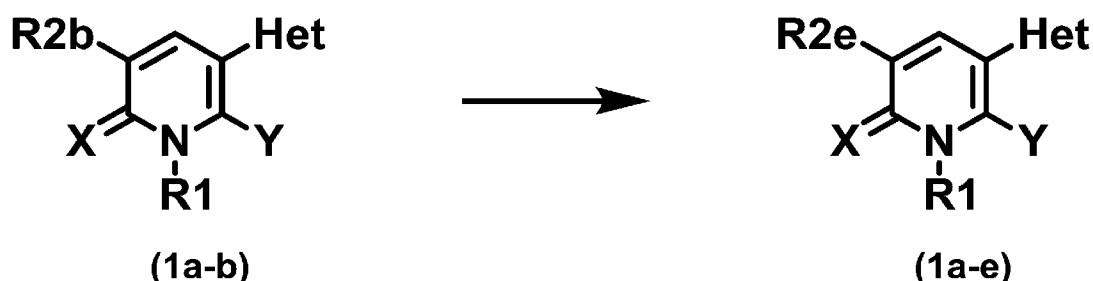
[0587] 前記で得られた式(1a-d)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0588] 前記で得られた式(1a-d)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0589] 溶媒留去後に得られた式(1a-d)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0590] [製造方法Ⅰ]

[化91]



[0591] 式中、R2eは置換基Aで適宜置換されてもよいC2~C6のアルキニル基、またはC2~C6のハロアルキニル基を表し、R1、Het、R2b、XおよびYは前記と同義である。

[0592] 製造方法Ⅰは、式(1a)で表される化合物のうち、R2eが置換基Aで

適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルキニル基、またはC₂～C₆のハロアルキニル基である式(1a-e)で表される化合物の合成方法であって、(1a-b)で表される化合物と末端アルキン化合物とを、遷移金属類および塩基の存在下、溶媒中で反応させる菌頭カップリングによって得ることを含む製造方法である。

[0593] 式(1a-b)中、好ましいR_{2b}は、塩素原子、臭素原子、またはヨウ素原子である。

[0594] 本反応に使用する末端アルキン化合物は、市販品として入手または公知の方法で製造することができる。また、末端アルキン化合物として、トリメチルシリルアセチレンも使用することができる。この場合は、式(1a-b)で表される化合物にトリメチルシリルエチニル基を導入後、脱シリル化を行う必要がある。脱シリル化については、ジャーナル オブ ザ アメリカン ケミカル ソサエティー (Journal of the American Chemical Society)、第131巻、2号、634-643頁(2009)、およびジャーナル オブ オルガノメタリック ケミストリー (Journal of Organometallic Chemistry)、696巻、25号、4039-4045頁(2011)、等の非特許文献を参考にして行うことができる。

[0595] 本反応に使用する末端アルキン化合物の量は、式(1a-b)で表される化合物に対して1当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、好ましくは、1当量以上10当量以下である。

[0596] 本反応に使用する遷移金属類は、配位子を有してよく、酢酸パラジウム、[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]パラジウムジクロリド、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウムジクロリド等のパラジウム類等である。また、塩化銅、臭化銅、ヨウ化銅等の銅類も同時に使用する。

- [0597] 本反応に使用する遷移金属類の量は、パラジウム類等および銅類が、それぞれ式（1 a - b）で表される化合物に対して0.001当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはない。好ましい量は、双方ともに0.001当量以上1当量以下である。
- [0598] 本反応に使用する塩基は、トリエチルアミン、トリブチルアミン、イソプロピルアミン、ジエチルアミン、ジイソプロピルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機アミン類や、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム等の無機塩基類等が挙げられる。
- [0599] 本反応に使用する塩基の量は、式（1 a - b）で表される化合物に対して1当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、好ましくは、1当量以上50当量以下である。また、有機塩基で液体状のものに関しては、溶媒として使用することができる。
- [0600] 本反応を効率的に進行させるために、トリ-*t*-ブチルホスフィン、2-ジシクロヘキシルホスフィノー-2',4',6'-トリイソプロピルビフェニル等のホスフィン配位子を添加することができるが、必須ではない。
- [0601] 本反応に使用するホスフィン配位子の量は、式（1 a - b）で表される化合物に対して0.001当量以上1当量以下であるが、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはない。
- [0602] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル-*t*-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、アセトニトリル等のニトリル系溶媒、*N*-メチルピロリドン、*N,N*-ジメチルホルムアミド、*N,N*-ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等のウレア系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、トリエチルアミン、トリブチルアミン

、イソプロピルアミン、ジエチルアミン、ジイソプロピルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機アミン溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0603] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(1a-b)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0604] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、0℃以上150℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0605] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtertブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。また、濾過操作を行うことにより、不溶物を除去することも可能であるが必須ではない。

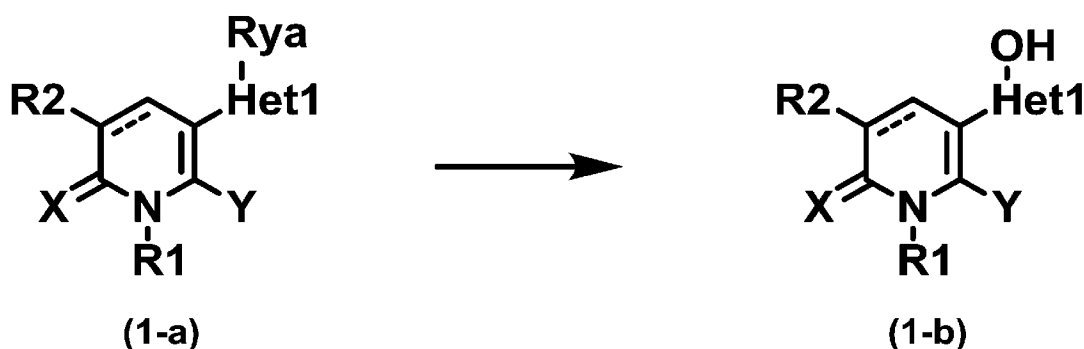
[0606] 前記で得られた式(1a-e)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0607] 前記で得られた式（１ a－e）で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0608] 溶媒留去後に得られた式（１ a－e）で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0609] [製造方法 J]

[化92]



[0610] 式中、R y aはC 1～C 6のアルコキシ基を表し、H e t 1は、5～6員の複素環基または8～10員の複素環基を表し、該5～6員の複素環基または該8～10員の複素環基は、R 3が、適宜0～5置換し（ただし、2置換以上のR 3がある場合、R 3はそれぞれ独立した置換基を表す。）、R 1、R 2、X、Yおよび破線部は前記と同義である。

[0611] 製造方法 Jは、式（１）で表される化合物のうち、水酸基を有する式（１－b）で表される化合物の合成方法であって、R y aがC 1～C 6のアルコキシ基である式（１－a）で表される化合物と酸とを、溶媒中で反応させることによって得ることを含む製造方法である。

[0612] 本反応に使用する酸として、三塩化ホウ素、三臭化ホウ素等のハロゲン化ホウ素類等がある。

[0613] 本反応に使用する酸の量は、式（１－a）で表される化合物に対して1当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、1当量以上10当量以下である。

- [0614] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、アセトニトリル等のニトリル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。
- [0615] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(1-a)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。
- [0616] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、-80℃以上100℃以下または溶媒の沸点以下である。
- [0617] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

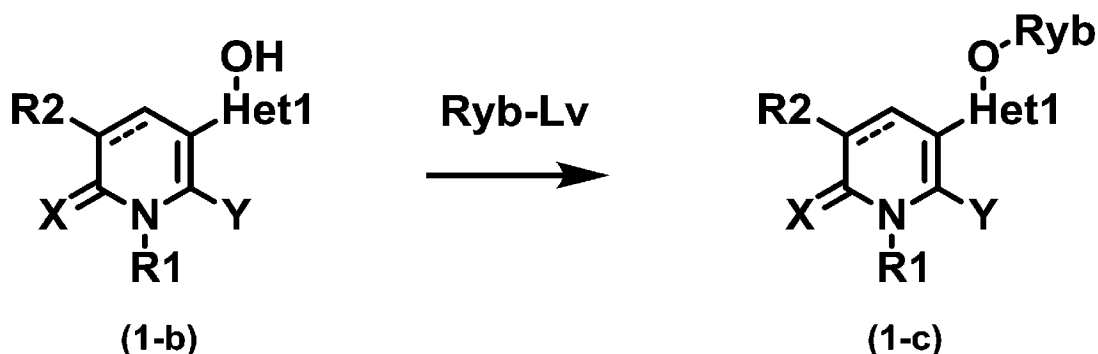
[0618] 前記で得られた式（１－ｂ）で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0619] 前記で得られた式（１－ｂ）で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0620] 溶媒留去後に得られた式（１－ｂ）で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0621] [製造方法Ｋ]

[化93]



[0622] 式中、R y bは、置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニル基、C 2～C 6のハロアルケニル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 6のアルキニル基、C 3～C 6のハロアルキニル基、置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基、置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基、置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキル基、またはR x 1 C (=O) -を表し、L v、R 1、R 2、H e t 1、R x 1、X、Yおよび破線部は前記と同義である。

[0623] 製造方法Kは、式（１）で表される化合物のうち、R y b - O -が置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、C 1～C 6のハロアルコキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルコキ

シ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルケニルオキシ基、C₂～C₆のハロアルケニルオキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₃～C₆のアルキニルオキシ基、C₃～C₆のハロアルキニルオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいアリールオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリールオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキルオキシ基、またはR_x1C(=O)O-(R_x1は、前記と同義である。)を表す式(1-c)で表される化合物の合成方法であって、式(1-b)で表される化合物とR_yb-L_vとを、塩基存在下、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0624] 本反応に使用するR_yb-L_vは、市販品として入手または公知の方法で製造することができる。

[0625] 本反応に使用するR_yb-L_vは、式(1-b)で表される化合物に対して1当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、1当量以上10当量以下である。

[0626] 本反応に使用する塩基として、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、水素化ナトリウム等の無機塩基類や、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、コリジン、ルチジン等の有機塩基類が例示されるが、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはない。

[0627] 本反応に使用する塩基は、式(1-b)で表される化合物に対して1当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、1当量以上10当量以下である。

[0628] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロ

ピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、アセトニトリル等のニトリル系溶媒、N-メチルピロリドン、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等のウレア系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の硫黄系溶媒、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0629] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(1-b)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0630] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、-20℃以上150℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0631] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル-tert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以

上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

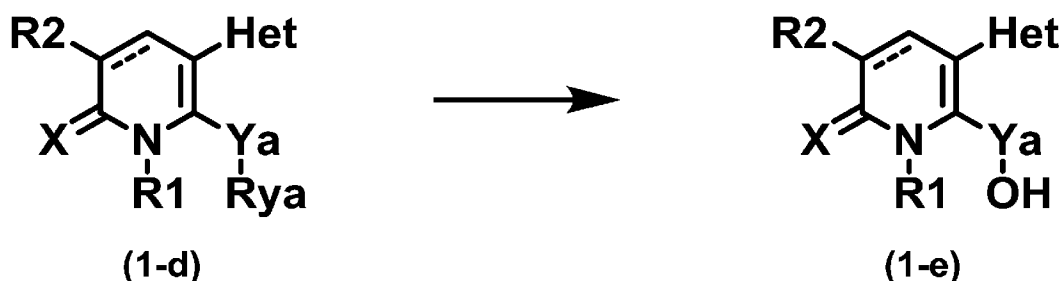
[0632] 前記で得られた式（1-c）で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0633] 前記で得られた式（1-c）で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0634] 溶媒留去後に得られた式（1-c）で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0635] [製造方法L]

[化94]



[0636] 式中、Y_aは、フェニル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、テトラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、またはチアジアゾリル基を表し、該フェニル基は、R_{ya}がオルト位に置換した場合、さらにR₅が適宜0～4置換し（ただし、2置換以上のR₅がある場合、R₅はそれぞれ独立した置換基を表す。）、R₄がオルト位に位置した場合、さらにR₅が適宜0～3置換し（ただし、2置換以上のR₅がある場合、R₅はそれぞれ独立した置換基を表す。）、該ピリジル基、該ピラジニル基、該ピリミジニル基、該ピリダジニル基、該トリアジニル基、または該テトラジニル基は、R_{ya}がオルト位に置換した場合、さらにR₅が適宜0～3置換し（ただし、2置換以上のR₅がある場合、R₅はそれぞれ独立した置換基を表す。）、R₄がオルト位に位

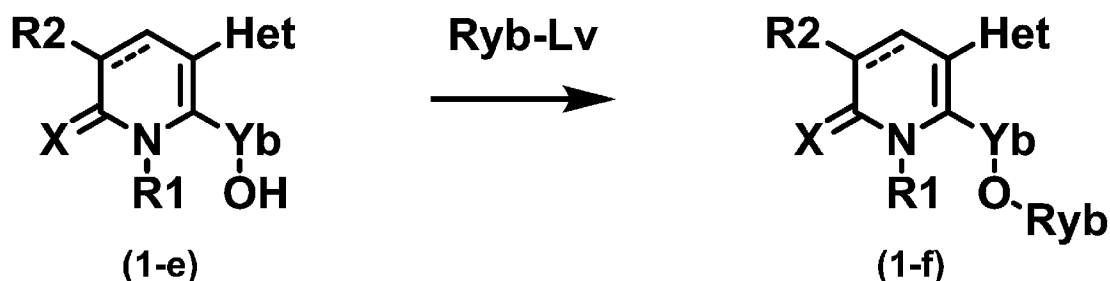
置した場合、さらに R⁵ が適宜 0～2 置換し（ただし、2 置換の R⁵ がある場合、R⁵ はそれぞれ独立した置換基を表す。）、R¹、R²、R^{ya}、X、Het および破線部は前記と同義である。

[0637] 製造方法 L は、式（1）で表される化合物のうち、Y に水酸基を有する式（1-e）で表される化合物の合成方法であって、式（1-d）で表される化合物と酸とを、溶媒中で反応させることによって得ることを含む製造方法である。

[0638] 製造方法 J における式（1-a）で表される化合物を、式（1-d）で表される化合物に代えて使用することにより、製造方法 J に準じて製造方法 L を実施することができる。

[0639] [製造方法 M]

[化95]



[0640] 式中、Y^b は、フェニル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、テトラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、またはチアジアゾリル基を表し、該フェニル基は、水酸基がオルト位に置換した場合、さらに R⁵ が適宜 0～4 置換し（ただし、2 置換以上の R⁵ がある場合、R⁵ はそれぞれ独立した置換基を表す。）、R⁴ がオルト位に位置した場合、さらに R⁵ が適宜 0～3 置換し（ただし、2 置換以上の R⁵ がある場合、R⁵ はそれぞれ独立した置換基を表す。）、該ピリジル基、該ピラジニル基、該ピリミジニル基、該ピリダジニル基、該トリアジニル基、または該テトラジニル基は、水酸基がオルト位に置換した場合、さらに R⁵ が適宜 0～3 置換し（ただし、2 置換以上の R⁵ がある場合、R⁵ はそれぞれ独立した置換基を表す。）、R⁴ がオルト位に位

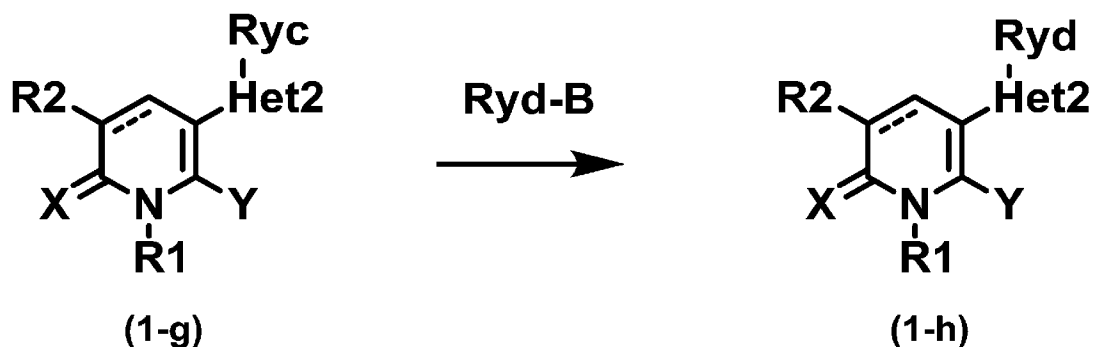
置した場合、さらにR 5が適宜0～2置換し（ただし、2置換のR 5がある場合、R 5はそれぞれ独立した置換基を表す。）、L v、R 1、R 2、H e t、R y b、X、および破線部は前記と同義である。ただし、式（1-e）で表される化合物中の水酸基および式（1-f）で表される化合物中のR y b-O-は、R 4あるいはR 5いずれか、または互いの置換基を表す。

[0641] 製造方法Mは、式（1）で表される化合物のうち、式（1-f）で表される化合物の合成方法であって、式（1-e）で表される化合物とR y b-L vとを、塩基存在下、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0642] 製造方法Kにおける式（1-b）で表される化合物を、式（1-e）で表される化合物に代えて使用することにより、製造方法Kに準じて製造方法Mを実施することができる。

[0643] [製造方法N]

[化96]



[0644] 式中、R y cはハロゲン原子を表し、R y dは置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニル基、C 2～C 6のハロアルケニル基、置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基、または置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基を表し、H e t 2は、5～6員の複素環基または8～10員の複素環基を表し、該5～6員の複素環基または該8～10員の複素環基は、R 3が、適宜0～5置換し（ただし、2置換以上のR 3がある場合、R 3はそれぞれ独立した置換基を表す。）、R y d-Bは有機ボロ

ン酸類を表し、R₁、R₂、X、Yおよび破線部は前記と同義である。

[0645] 製造方法Nは、式(1)で表される化合物のうち、R_{y d}が置換基Cで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルキル基、C₁～C₆のハロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₃～C₈のシクロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルケニル基、C₂～C₆のハロアルケニル基、置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基、または置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基である式(1-h)で表される化合物の合成方法であって、式(1-g)で表される化合物と有機ボロン酸類(R_{y d}-B)とを、遷移金属類および塩基の存在下、溶媒中で反応させる鈴木-宮浦カップリングによって得ることを含む製造方法である。

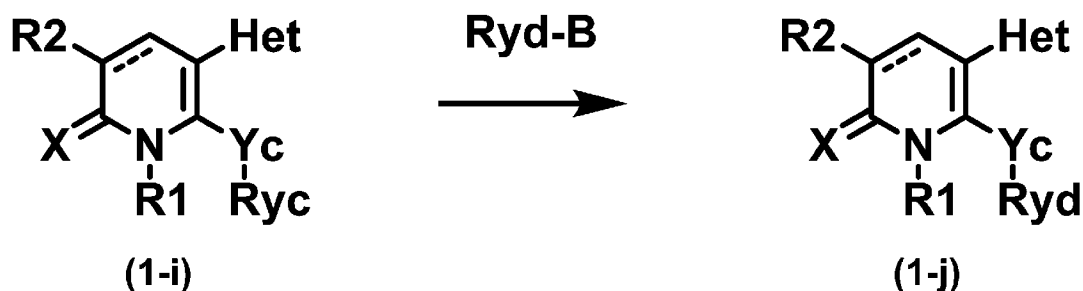
[0646] 式(1-g)で表される化合物中、好ましいR_{y c}は、塩素原子、臭素原子、またはヨウ素原子である。

[0647] 本反応に使用するR_{y d}-Bは、有機ボロン酸や有機ボロン酸エステル等の有機ボロン酸類を表し、市販品として入手または公知の方法で製造できる。

[0648] 製造方法Hにおける式(1a-b)で表される化合物とR_{2 d}-Bとを、それぞれ式(1-g)で表される化合物とR_{y d}-Bとに代えて使用することにより、製造方法Hに準じて製造方法Nを実施することができる。

[0649] [製造方法O]

[化97]



[0650] 式中、Y_cは、フェニル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、テトラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、またはチアジアゾリル基を表し、該フェニル基

は、R y c がオルト位に置換した場合、さらにR 5 が適宜0～4置換し（ただし、2置換以上のR 5 がある場合、R 5 はそれぞれ独立した置換基を表す。）、R 4 がオルト位に位置した場合、さらにR 5 が適宜0～3置換し（ただし、2置換以上のR 5 がある場合、R 5 はそれぞれ独立した置換基を表す。）、該ピリジル基、該ピラジニル基、該ピリミジニル基、該ピリダジニル基、該トリアジニル基、または該テトラジニル基は、R y c がオルト位に置換した場合、さらにR 5 が適宜0～3置換し（ただし、2置換以上のR 5 がある場合、R 5 はそれぞれ独立した置換基を表す。）、R 4 がオルト位に位置した場合、さらにR 5 が適宜0～2置換し（ただし、2置換のR 5 がある場合、R 5 はそれぞれ独立した置換基を表す。）、R y c、R y d、R y d-B、R 1、R 2、X、H e t および破線部は前記と同義である。ただし、式（1-i）で表される化合物中のR y c および式（1-j）で表される化合物中のR y d は、R 4 あるいはR 5 に該当するいずれか、または互いの置換基を表す。

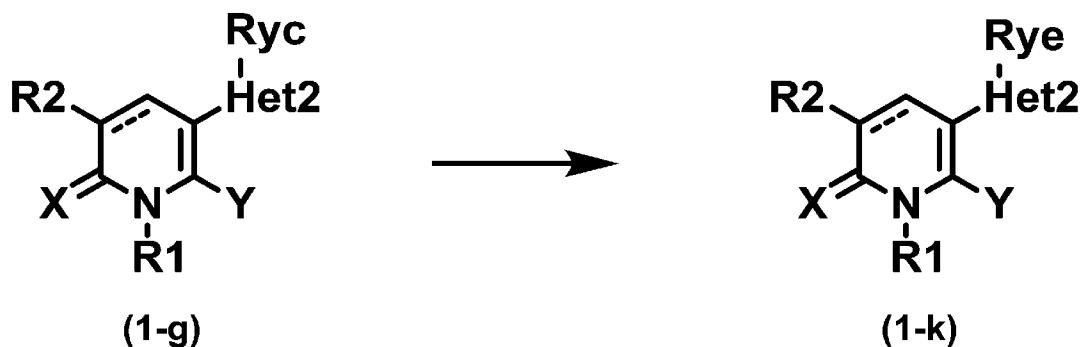
[0651] 製造方法Oは、式（1）で表される化合物のうち、式（1-j）で表される化合物の合成方法であって、式（1-i）で表される化合物と有機ボロン酸類（R y d-B）とを、遷移金属類および塩基の存在下、溶媒中で反応させる鈴木-宮浦カップリングによって得ることを含む製造方法である。

[0652] 式（1-i）で表される化合物中、好ましいR y c は、塩素原子、臭素原子、またはヨウ素原子である。

[0653] 製造方法Hにおける式（1a-b）で表される化合物とR 2 d-Bとを、それぞれ式（1-i）で表される化合物とR y d-Bとに代えて使用することにより、製造方法Hに準じて製造方法Oを実施することができる。

[0654] [製造方法P]

[化98]



[0655] 式中、R y eは置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、またはC 2～C 6のハロアルキニル基を表し、R y c、R 1、R 2、X、Y、H e t 2および破線部は前記と同義である。

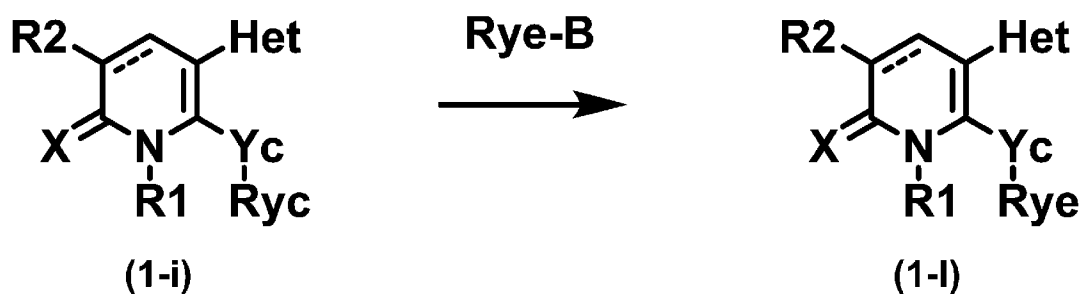
[0656] 製造方法Pは、式（1）で表される化合物のうち、R y eが置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、またはC 2～C 6のハロアルキニル基である式（1－k）で表される化合物の合成方法であって、式（1－g）で表される化合物と末端アルキン化合物とを、遷移金属類および塩基の存在下、溶媒中で反応させる菌頭カップリングによって得ることを含む製造方法である。

[0657] 式（1－g）で表される化合物中、好ましいR y cは、塩素原子、臭素原子、またはヨウ素原子である。

[0658] 製造方法Iにおける式（1 a－b）で表される化合物を式（1－g）で表される化合物に代えて使用することにより、製造方法Iに準じて製造方法Pを実施することができる。

[0659] [製造方法Q]

[化99]



[0660] 式中、R_{yc}、R_{ye}、R₁、R₂、X、Y_c、Het および破線部は前記と同義である。ただし、式(1-i)で表される化合物中のR_{yc}および式(1-l)で表される化合物中のR_{ye}は、R₄あるいはR₅に該当するいずれか、または互いの置換基を表す。

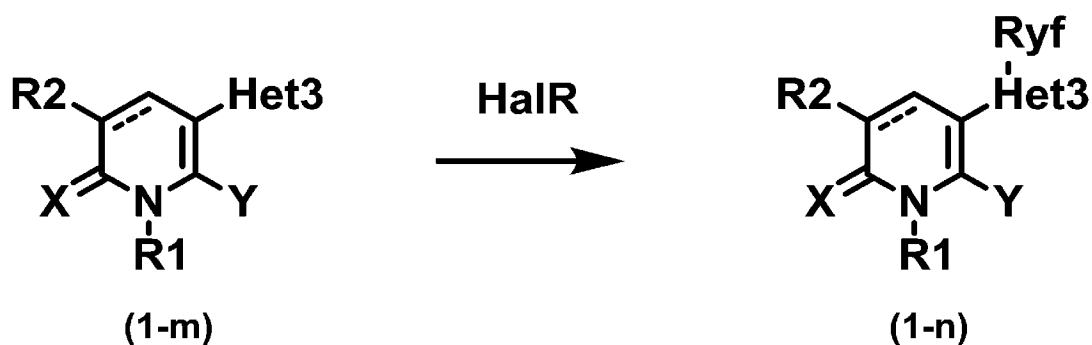
[0661] 製造方法Qは、式(1)で表される化合物のうち、式(1-l)で表される化合物の合成方法であって、式(1-i)で表される化合物と末端アルキン化合物とを、遷移金属類および塩基の存在下、溶媒中で反応させる菌頭カップリングによって得ることを含む製造方法である。

[0662] 式(1-i)で表される化合物中、好ましいR_{yc}は、塩素原子、臭素原子、またはヨウ素原子である。

[0663] 製造方法Iにおける式(1a-b)で表される化合物を式(1-i)で表される化合物に代えて使用することにより、製造方法Iに準じて製造方法Qを実施することができる。

[0664] [製造方法R]

[化100]



[0665] 式中、R_{yf}はハロゲン原子を表し、Het₃は、5～6員の複素環基または8～10員の複素環基を表し、該5～6員の複素環基または該8～10員の複素環基は、R₃が、適宜0～5置換し（ただし、2置換以上のR₃がある場合、R₃はそれぞれ独立した置換基を表す。）、HalR、R₁、R₂、X、Yおよび破線部は前記と同義である。

[0666] 製造方法Rは、式(1)で表される化合物のうち、R_{yf}がハロゲン原子である式(1-n)で表される化合物を得る製造方法であって、式(1-m

）で表される化合物とハロゲン化剤（H a l R）とを、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0667] 本反応は、塩基やラジカル開始剤を添加することができる。目的とする反応が進行するよう適宜設定すればよい。

[0668] 以下、式（1－m）で表される化合物とハロゲン化剤（H a l R）とを、溶媒中で反応させる方法について説明する。

[0669] 本反応に使用するハロゲン化剤としては、セレクトロフルオル（N－フルオローN’－トリエチレンジアミン ビス（テトラフルオロボラート））、N－クロロスクシンイミド、N－ブロモスクシンイミド、N－ヨードスクシンイミド、1，3－ジクロロ－5，5－ジメチルヒダントイン、1，3－ジブromo－5，5－ジメチルヒダントイン、1，3－ジヨード－5，5－ジメチルヒダントイン、臭素、ヨウ素等が挙げられる。

[0670] 本反応に使用するハロゲン化剤の量は、式（1－m）で表される化合物に対して1当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、1当量以上10当量以下である。ただし、ヒダントインを含むハロゲン化剤の量は、0.5当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはなく、好ましくは1当量以上5当量以下である。

[0671] 本反応に使用するハロゲン化剤がヨウ素化剤である場合、塩酸、硫酸等の無機酸類や、酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸等の有機酸のような酸を加えることができる。

[0672] 本反応に使用するハロゲン化剤がヨウ素化剤である場合に使用する酸の量は、式（1－m）で表される化合物に対して0.01当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、0.1当量以上3当量以下である。

[0673] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、硫酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸等の酸性系溶媒、ジエチルエーテル、ジイ

ソプロピルエーテル、メチル tert-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、アセトニトリル等のニトリル系溶媒、N-メチルピロリドン、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等のウレア系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0674] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(1-m)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0675] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、0℃以上150℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0676] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル tert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素

等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

[0677] 前記で得られた式(1-n)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0678] 前記で得られた式(1-n)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0679] 溶媒留去後に得られた式(1-n)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0680] 以下、式(1-m)で表される化合物とハロゲン化剤(HalR)とを、塩基存在下、溶媒中で反応させる方法について説明する。

[0681] 本反応に使用するハロゲン化剤としては、セレクトロフルオル(N-フルオロ-N'-トリエチレンジアミンビス(テトラフルオロボラート))、N-クロロスクシンイミド、N-ブロモスクシンイミド、N-ヨードスクシンイミド、1,3-ジクロロ-5,5-ジメチルヒダントイン、1,3-ジブromo-5,5-ジメチルヒダントイン、1,3-ジヨード-5,5-ジメチルヒダントイン、ヘキサクロロエタン、臭素、ヨウ素等が挙げられる。

[0682] 本反応に使用するハロゲン化剤の量は、式(1-m)で表される化合物に対して1当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、1当量以上10当量以下である。ただし、ヒダントインを含むハロゲン化剤の量は、0.5当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはなく、好ましくは1当量以上5当量以下である。

[0683] 本反応に使用する塩基として、水素化ナトリウム等の金属ヒドリド類、メ

チルリチウム、ブチルリチウム、*sec*-ブチルリチウム、*tert*-ブチルリチウム、ヘキシルリチウム等の有機リチウム類や、リチウムジイソプロピルアミド、ヘキサメチルジシラザンリチウム、ヘキサメチルジシラザンナトリウム、ヘキサメチルジシラザンカリウム等の金属アミド類が例示されるが、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはない。

[0684] 本反応に使用する塩基の量は、式(1-m)で表される化合物に対して1当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、1当量以上10当量以下である。

[0685] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル-*tert*-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、*N*-メチルピロリドン、*N*, *N*-ジメチルホルムアミド、*N*, *N*-ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等のウレア系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0686] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(1-m)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0687] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、-80℃以上100℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0688] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、

亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

[0689] 前記で得られた式(1-n)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0690] 前記で得られた式(1-n)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0691] 溶媒留去後に得られた式(1-n)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0692] 以下、式(1-m)で表される化合物、ハロゲン化剤(HalR)、およびラジカル開始剤とを、溶媒中で反応させる方法について説明する。

[0693] 本反応に使用するラジカル開始剤は、アゾビスイソブチロニトリル、2,2'-アゾビス(4-メトキシ-2,4-ジメチルバレロニトリル)、過酸化ベンゾイル等が挙げられる。

[0694] 本反応に使用するラジカル開始剤の量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(1-m)で表される化合物に対して0.01当量以上1.0当量以下である。

[0695] 本反応に使用するハロゲン化剤は、N-クロロスクシンイミド、N-ブロ

モスクシンイミド、N-ヨードスクシンイミド、1, 3-ジクロロ-5, 5-ジメチルヒダントイン、1, 3-ジブromo-5, 5-ジメチルヒダントイン、1, 3-ジヨード-5, 5-ジメチルヒダントイン等が挙げられる。

[0696] 本反応に使用するハロゲン化剤の量は、式(1-m)で表される化合物に対して1当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、1当量以上1.8当量以下である。

[0697] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化ベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0698] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(1-m)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0699] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、20℃以上150℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0700] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチル

エーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtertブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

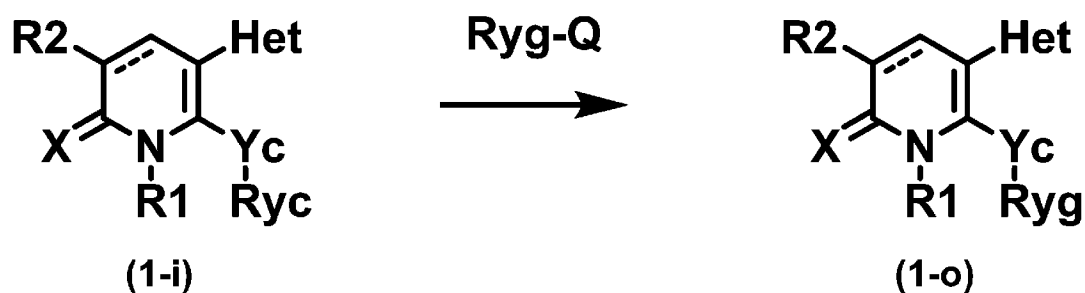
[0701] 前記で得られた式(1-n)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0702] 前記で得られた式(1-n)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0703] 溶媒留去後に得られた式(1-n)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0704] [製造方法S]

[化101]



[0705] 式中、Rygは、置換基Cで適宜置換されてもよいC1～C6のアルコキシ基、C1～C6のハロアルコキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC3～C8のシクロアルコキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC2～C6のアルケニルオキシ基、C2～C6のハロアルケニルオキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC3～C6のアルキニルオキシ基、C3～C6のハロアルキニルオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基

、置換基Dで適宜置換されてもよいアリールオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリールオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキルオキシ基、 $R^a R^b N-$ （ここで R^a および R^b は前記と同義である）、 R^c-L- （ここで、 R^c および L は前記と同義である。）、または $R^{x4} R^{x5} C=N-O-$ （ここで R^{x4} および R^{x5} は前記と同義である。）を表し、 R^1 、 R^2 、 R^{yc} 、 Het 、 X 、 Y^c 、 Q 、および破線部は前記と同義である。ただし、式（1-i）で表される化合物中の R^{yg} および式（1-o）で表される化合物中の R^{yg} は、 R^4 あるいは R^5 に該当するいずれか、または互いの置換基を表す。

[0706] 製造方法Sは、式（1）で表される化合物のうち、 R^{yg} が置換基Cで適宜置換されてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ のハロアルコキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよい $C_3 \sim C_8$ のシクロアルコキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよい $C_2 \sim C_6$ のアルケニルオキシ基、 $C_2 \sim C_6$ のハロアルケニルオキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよい $C_3 \sim C_6$ のアルキニルオキシ基、 $C_3 \sim C_6$ のハロアルキニルオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基、置換基Dで適宜置換されてもよいアリールオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリールオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキルオキシ基、 $R^a R^b N-$ （ここで R^a および R^b は前記と同義である）、 R^c-L- （ここで、 R^c および L は前記と同義である。）、または $R^{x4} R^{x5} C=N-O-$ （ここで R^{x4} および R^{x5} は前記と同義である。）である式（1-o）で表される化合物を得る方法であって、式（1-i）で表される化合物と $R^{yg}-Q$ とを、塩基の存在下、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0707] 式（1-i）で表される化合物中、好ましい R^{yc} は、フッ素原子、塩素原子、または臭素原子である。

[0708] 本反応で使用される $R^{yg}-Q$ は、市販品として入手または公知の方法で製造できる。好ましい Q は、水素原子、またはナトリウム、カリウム等のアルカリ金属類である。

- [0709] 本反応で使用される R_yg-Q の量は、式 (1-i) で表される化合物に対して 1 当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、1 当量以上 30 当量以下である。また、 Q が水素原子を表すときは、溶媒として使用することができる。
- [0710] 本反応に使用する塩基は、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、水素化ナトリウム等の無機塩基類が好ましい。また、 Q がアルカリ金属類のときは、塩基の使用は必須ではない。
- [0711] 本反応に使用する塩基の量は、式 (1-i) で表される化合物に対して 1 当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、1 当量以上 30 当量以下である。
- [0712] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、 R_yg-H (式中、 R_yg は前記と同義である。) で表されるアルコール系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル tert-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、アセトニトリル等のニトリル系溶媒、 N -メチルピロリドン、 N 、 N -ジメチルホルムアミド、 N 、 N -ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等のウレア系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の硫黄系溶媒、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または 2 種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。
- [0713] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式 (1-i) で表される化合物に対して 3 重量倍以上 200 重量倍以下である。
- [0714] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限

定されることはないが、通常、0℃以上150℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0715] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

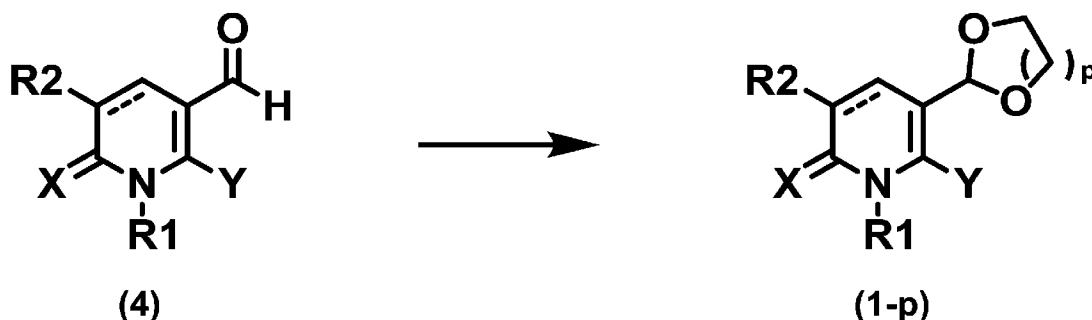
[0716] 前記で得られた式(1-0)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0717] 前記で得られた式(1-0)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0718] 溶媒留去後に得られた式(1-0)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0719] [製造方法T]

[化102]



[0720] 式中、 p は、1～2の整数を表し、 $R1$ 、 $R2$ 、 X 、 Y および破線部は前記と同義である。

[0721] 製造方法Tは、式(1)で表される化合物のうち、Hetが1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基である式(1-p)で表される化合物の合成方法であって、式(4)で表される化合物とグリコール類とを、酸存在下、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0722] 本反応に使用する式(4)で表される化合物は、参考例を参照にして入手することができる。

[0723] 本反応に使用する酸として、塩酸、硫酸等の無機酸類、p-トルエンスルホン酸等の有機酸類が例示され、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定することはない。

[0724] 本反応に使用する酸の量は、式(4)で表される化合物に対して、0.01当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、0.1当量以上1当量以下である。

[0725] 本反応に使用するグリコール類として、エチレングリコール、プロピレングリコール等が例示され、市販品として入手または公知の方法で製造することができる。

本反応に使用するグリコール類の量としては、式(4)で表される化合物に対して、1当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、1当量以上30当量以下である。

[0726] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限

定されることはないが、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0727] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(4)で表される化合物に対して1重量倍以上200重量倍以下である。

[0728] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、 -80°C 以上 150°C 以下または溶媒の沸点以下である。

[0729] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル tert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

[0730] 前記で得られた式(1-p)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸

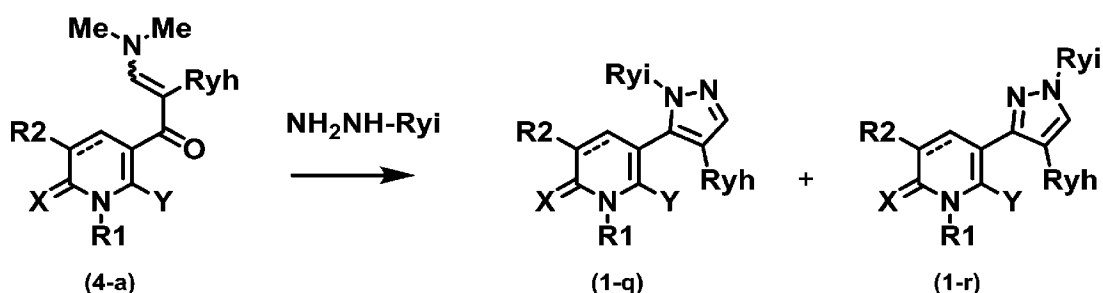
ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0731] 前記で得られた式（1-p）で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0732] 溶媒留去後に得られた式（1-p）で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0733] [製造方法U]

[化103]



[0734] 式中、R y hは、水素原子、水酸基、シアノ基、ハロゲン原子、置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニル基、C 2～C 6ハロアルケニル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、C 2～C 6のハロアルキニル基、置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基、置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基、置換基Dで適宜置換されてもよいアリールオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリールオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキルオキシ基、R x 1 C (=O) - (ここでR x 1は、前記と同義である。)、またはR x 1 C (=O) O - (ここでR x 1は、前記と同義である。)を表し、R y iは、水素原子、置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアル

ケニル基、C 2～C 6 ハロアルケニル基、置換基Cで適宜置換されてもよい C 2～C 6 のアルキニル基、C 2～C 6 のハロアルキニル基、置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基、または置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基を表し、R 1、R 2、X、Yおよび破線部は前記と同義である。

[0735] 製造方法Uは、式(1)で表される化合物のうち、式(1-q)で表される化合物および式(1-r)で表される化合物の合成方法であって、式(4-a)で表される化合物とNH₂NH-R_{y i}とを、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0736] 式(1-q)で表される化合物および式(1-r)で表される化合物は、それらの比率はどちらか一方が単独、あるいは任意の割合の混合物であってよく、特に限定されることはない。

[0737] 本反応に使用する式(4-a)で表される化合物は、参考例を参照にして入手することができる。

[0738] 本反応で使用されるNH₂NH-R_{y i}は、市販品として入手または公知の方法で製造できる。NH₂NH-R_{y i}は、塩酸、酢酸のような酸性化合物との塩を形成したものでよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはない。

[0739] 本反応で使用されるNH₂NH-R_{y i}の量は、式(4-a)で表される化合物に対して1当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、1当量以上30当量以下である。

[0740] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール等のアルコール系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル-tert-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、N-メチルピロリドン、N

、N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等のウレア系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の硫黄系溶媒、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0741] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(4-a)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0742] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、0℃以上150℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0743] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル-tert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限される

ことがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

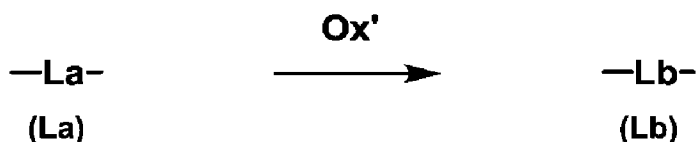
[0744] 前記で得られた式 (1 - q) で表される化合物および式 (1 - r) で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0745] 前記で得られた式 (1 - q) で表される化合物および式 (1 - r) で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0746] 溶媒留去後に得られた式 (1 - q) で表される化合物および式 (1 - r) で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0747] [製造方法 V]

[化104]



[0748] 式中、L a は S を表し、L b は S O または S O₂ を表し、O x' は酸化剤を表す。

[0749] 製造方法 V は、式 (1) で表される化合物中、R 2、R 3、R 4、R 5、置換基 A および置換基 C に含まれる L b が S O または S O₂ である式 (L b) で表される化合物の製造方法であって、式 (1) で表される化合物中、R 2、R 3、R 4、R 5、置換基 A および置換基 C に含まれる L a が S である式 (L a) で表される化合物と酸化剤 (O x') とを、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0750] 本反応に使用する酸化剤は、過酸化水素水、メタクロロ過安息香酸等の過酸化物類等が挙げられる。また、タングステン酸ナトリウムのような遷移金属類を添加することもできる。

[0751] 本反応に使用する酸化剤の量は、S O を製造する際には式 (L a) で表さ

れる化合物に対して、通常、1.0当量以上1.2当量以下であり、SO₂を製造する際には、通常、2当量以上10当量以下である。また、遷移金属類を添加する際には、通常、0.001当量以上1当量以下である。

[0752] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、水溶媒、酢酸等の酸性系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、アセトニトリル等のニトリル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0753] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(La)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0754] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、-10℃以上120℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0755] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロ

ヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

[0756] 前記で得られた式 (L b) で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

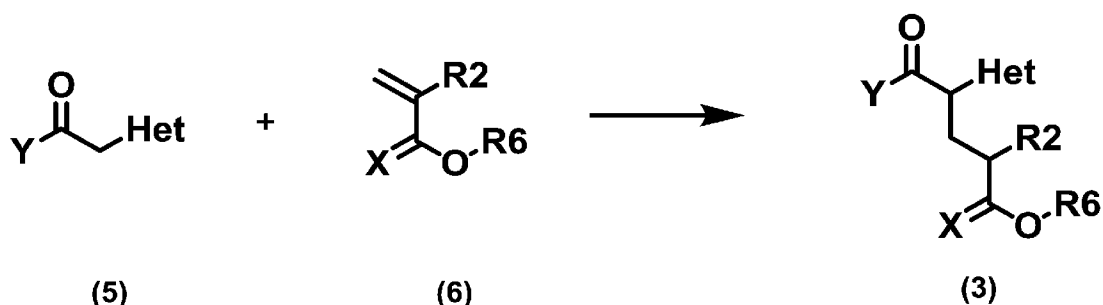
[0757] 前記で得られた式 (L b) で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0758] 溶媒留去後に得られた式 (L b) で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0759] 次に製造方法 A に記載されている式 (3) で表される化合物の合成方法について記載する。

[0760] [製造方法 W]

[化105]



[0761] 式中、R₂、R₆、Het、XおよびYは、前記と同義である。

[0762] 製造方法 W は、式 (3) で表される製造中間体の製造方法であって、式 (5) で表される化合物と式 (6) で表される化合物とを、塩基の存在下、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0763] 本反応に使用する式 (5) で表される化合物は、参考例に準じて合成することができる。また、グリーン ケミストリー (Green Chemistry)、第 41 巻、580-585 頁や、ザ ジャーナル オブ オルガ

ニック ケミストリー (The Journal of Organic Chemistry)、第65巻、20号、6458-6461頁(2000)、や、米国特許第5922718号等を参照にしても合成することができる。

[0764] 本反応に使用する式(6)で表される化合物は、市販品として入手または公知の方法で製造することができる。

[0765] 本反応に使用する式(6)で表される化合物の量は、式(5)で表される化合物に対して1当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは1当量以上3当量以下である。

[0766] 本反応に使用する塩基は、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、リン酸三カリウムのような無機塩基類やナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム *t*-ブトキシド等の金属アルコキシド類等である。

[0767] 本反応に使用する塩基は、触媒量で実施することが可能であり、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、好ましくは、式(5)で表される化合物に対して0.01当量以上3当量以下である。

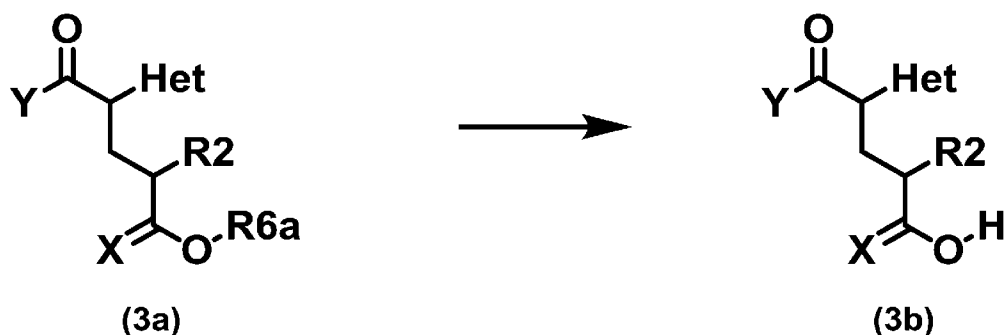
[0768] 本反応に使用する溶媒は、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル *t*-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、アセトニトリル等のニトリル系溶媒、*N*-メチルピロリドン、*N*, *N*-ジメチルホルムアミド、*N*, *N*-ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等のウレア系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の硫黄系溶媒、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

- [0769] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式（５）で表される化合物に対して３重量倍以上２００重量倍以下である。
- [0770] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、－５０℃以上１５０℃以下または溶媒の沸点以下である。
- [0771] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル tert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、２種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。
- [0772] 前記で得られた式（３）で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。
- [0773] 前記で得られた式（３）で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。
- [0774] 溶媒留去後に得られた式（３）で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて

精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0775] [製造方法X]

[化106]



[0776] 式中、R 6 aはC 1～C 6のアルキル基を表し、R 2、H e t、XおよびYは、前記と同義である。

[0777] 製造方法Xは、式(3)で表される化合物のうち、式(3b)で表される製造中間体の製造方法であって、式(3a)で表される化合物を、酸性条件または塩基性条件下、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0778] まず、酸性条件の反応について説明する。

[0779] 本反応に使用する酸は、塩酸、臭化水素酸、リン酸等の無機酸類や、酢酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸類が例示される。目的とする反応が進行する限り特に制限されることはない。

[0780] 本反応に使用する酸の量は、触媒量でもよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、式(3a)で表される化合物に対して0.01当量以上である。また、液体状の酸に関しては溶媒として使用することも可能である。

[0781] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、水溶媒、酢酸、メタンスルホン酸等の酸性系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル-tert-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール系溶媒、ベン

ゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、アセトニトリル等のニトリル系溶媒、N-メチルピロリドン、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等のウレア系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0782] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(3a)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0783] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、0℃以上180℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0784] 次に、塩基性条件の反応について説明する。

[0785] 本反応に使用する塩基は、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の無機塩基類が例示されるが、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはない。

[0786] 本反応に使用する塩基は、式(3a)で表される化合物に対して1当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、好ましくは、1当量以上30当量以下である。

[0787] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、水溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル-tert-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、アセトニトリル等のニトリ

ル系溶媒、N-メチルピロリドン、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等のウレア系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0788] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(3a)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0789] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、-20℃以上180℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0790] 反応の後処理は、酸性条件での反応と塩基性条件の反応は共通の方法で行える。反応混合物に対して、水、もしくは適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル-tert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

[0791] 前記で得られた式(3b)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナ

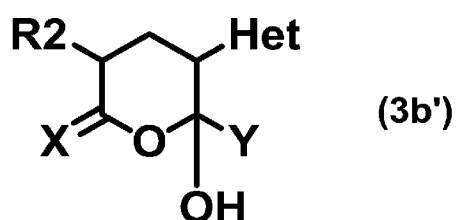
トリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0792] 前記で得られた式(3b)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0793] 溶媒留去後に得られた式(3b)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0794] 式(3b)で表される化合物は、式(3b'))

[化107]



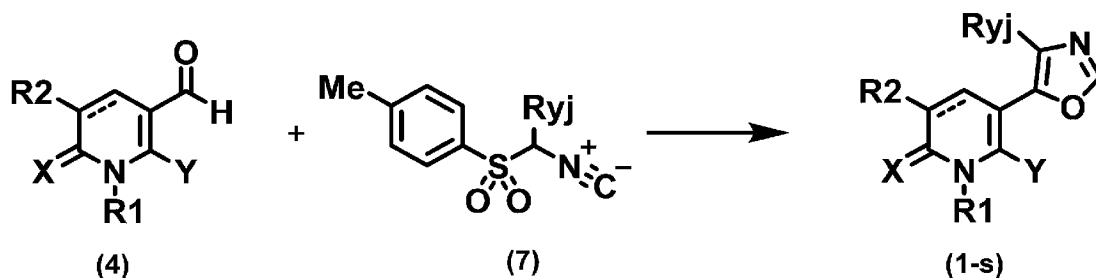
(式中、R₂、Het、XおよびYは前記と同義である。)

で表される異性体も含む。

[0795] 式(3b')で表される化合物は、式(3b)で表される化合物と同様に取り扱うことが可能であり、製造方法Aを適応することができる。また、式(3b')で表される化合物は不斉炭素を含むが、その異性体混合比は、単独でも任意の割合の混合物でもよい。さらに、式(3b)で表される化合物と式(3b')で表される化合物との混合物でもよく、その異性体混合比は、単独でも任意の割合の混合物でもよい。

[0796] [製造方法Y]

[化108]



- [0797] 式中、 R_{y_j} は、水素原子、置換基Cで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC3～C8のシクロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC2～C6のアルケニル基、C2～C6ハロアルケニル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC2～C6のアルキニル基、C2～C6のハロアルキニル基、置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基、または置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基を表し、R1、R2、X、Yおよび破線部は前記と同義である。
- [0798] 製造方法Yは、式(1)で表される化合物のうち、式(1-s)で表される化合物の合成方法であって、式(4)で表される化合物と式(7)で表される化合物とを、塩基の存在下、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。
- [0799] 本反応に使用する式(4)で表される化合物は、参考例を参照にして入手することができる。
- [0800] 本反応で使用される式(7)で表される化合物は、市販品として入手または公知の方法で製造できる。
- [0801] 本反応で使用される式(7)で表される化合物の量は、式(4)で表される化合物に対して1当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、1当量以上10当量以下である。
- [0802] 本反応に使用する塩基は、水素化ナトリウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、リン酸三カリウムのような無機塩基類やナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム *tert*-ブトキシド等の金属アルコキシド類等が例示されるが、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはない。
- [0803] 本反応に使用する塩基の量は、式(4)で表される化合物に対して1当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、1当量以上10当量以下である。

- [0804] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール等のアルコール系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル-*t*-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、*N*-メチルピロリドン、*N*，*N*-ジメチルホルムアミド、*N*，*N*-ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒、1，3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等のウレア系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の硫黄系溶媒、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。
- [0805] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(4)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。
- [0806] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、0℃以上150℃以下または溶媒の沸点以下である。
- [0807] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、

酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

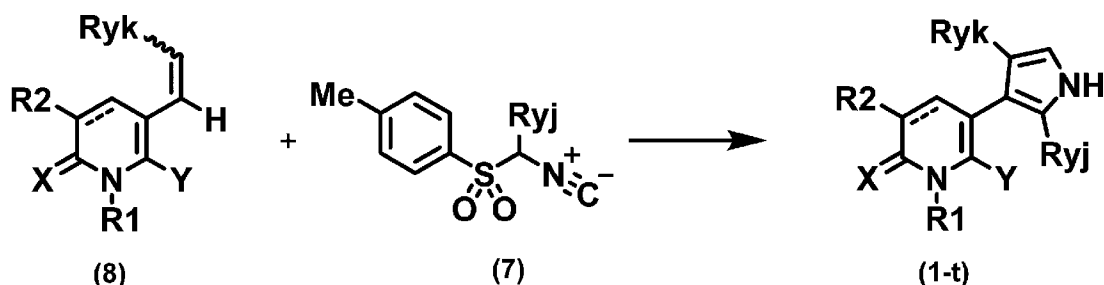
[0808] 前記で得られた式(1-s)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0809] 前記で得られた式(1-s)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0810] 溶媒留去後に得られた式(1-s)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0811] [製造方法Z]

[化109]



[0812] 式中、R y k は、水素原子、シアノ基、ニトロ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC3～C8のシクロアルキル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC2～C6のアルケニル基、C2～C6ハロアルケニル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC2～C6のアルキニル基、C2～C6

のハロアルキニル基、置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、C 1～C 6のハロアルコキシ基、または $R \times 1 C(=O)-$ （ここで $R \times 1$ は、前記と同義である。）を表し、 R_1 、 R_2 、 $R_{y j}$ 、X、Yおよび破線部は前記と同義である。

[0813] 製造方法Zは、式（1）で表される化合物のうち、式（1-t）で表される化合物の合成方法であって、式（8）で表される化合物と式（7）で表される化合物とを、塩基の存在下、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0814] 本反応に使用する式（8）で表される化合物は、参考例を参照にして入手することができる。式（8）で表される化合物は幾何異性体を含むが、その異性体混合比は、単独でも任意の割合の混合物でもよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはない。

[0815] 本反応で使用される式（7）で表される化合物は、市販品として入手または公知の方法で製造できる。

[0816] 本反応で使用される式（7）で表される化合物の量は、式（8）で表される化合物に対して1当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、1当量以上10当量以下である。

[0817] 本反応に使用する塩基は、水素化ナトリウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、リン酸三カリウムのような無機塩基類やナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム t -ブトキシド等の金属アルコキシド類等が例示されるが、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはない。

[0818] 本反応に使用する塩基の量は、式（8）で表される化合物に対して1当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、1当量以上10当量以下である。

[0819] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール

ル等のアルコール系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルーtert-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、N-メチルピロリドン、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等のウレア系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の硫黄系溶媒、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0820] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(8)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0821] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、0℃以上150℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0822] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルーtert-ブチルエーテル等のエー

テル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

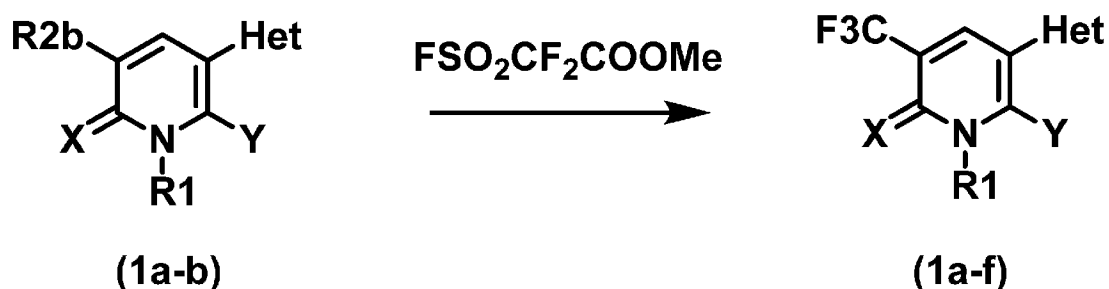
[0823] 前記で得られた式(1-t)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0824] 前記で得られた式(1-t)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0825] 溶媒留去後に得られた式(1-t)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0826] [製造方法A A]

[化110]



[0827] 式中、R1、Het、R2b、XおよびYは前記と同義である。

[0828] 製造方法A Aは、式(1a)で表される化合物のうち、トリフルオロメチル基を有する式(1a-f)で表される化合物の合成方法であって、式(1a-b)で表される化合物とジフルオロ(フルオロスルホニル)酢酸メチルとを、遷移金属類存在下で反応させることを含む製造方法である。

[0829] 式(1a-b)で表される化合物中、好ましいR2bは、塩素原子、臭素原子、またはヨウ素原子である。

- [0830] 本反応に使用するジフルオロ（フルオロスルホニル）酢酸メチルは、市販品として入手または公知の方法で製造できる。
- [0831] 本反応に使用するジフルオロ（フルオロスルホニル）酢酸メチルの量は、式（1 a - b）で表される化合物に対して、1 当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、好ましくは、1 当量以上 50 当量以下である。
- [0832] 本反応に使用する遷移金属類は、銅類等である。好ましくは、臭化銅やヨウ化銅等が挙げられる。
- [0833] 本反応に使用する遷移金属類の量は、式（1 a - b）で表される化合物に対して、1 当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、1 当量以上 50 当量以下である。
- [0834] 本反応を効率的に進行させるために、エチルジイソプロピルアミンやヘキサメチルリン酸トリアミド等の添加剤を加えることができるが必須ではない。
- [0835] 本反応に使用する添加剤の量は、式（1 a - b）で表される化合物に対して 50 当量以下であり、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはない。
- [0836] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、N-メチルピロリドン、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の硫黄系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。
- [0837] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式（1 a - b）で表される化合物に対して 3 重量倍以上 200 重量倍以下である。
- [0838] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、0℃以上 150℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0839] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、アンモニア、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル tert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

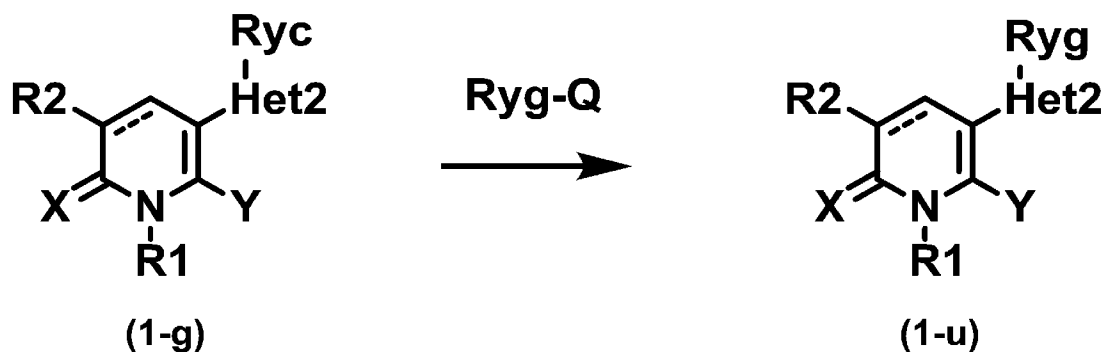
[0840] 前記で得られた式(1a-f)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0841] 前記で得られた式(1a-f)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0842] 溶媒留去後に得られた式(1a-f)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0843] [製造方法A B]

[化111]



[0844] 式中、R1、R2、Ryc、Ryg、Het2、X、Y、Q、および破線部は前記と同義である。

[0845] 製造方法ABは、式(1)で表される化合物のうち、Rygが置換基Cで適宜置換されてもよいC1～C6のアルコキシ基、C1～C6のハロアルコキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC3～C8のシクロアルコキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC2～C6のアルケニルオキシ基、C2～C6のハロアルケニルオキシ基、置換基Cで適宜置換されてもよいC3～C6のアルキニルオキシ基、C3～C6のハロアルキニルオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリアル基、置換基Dで適宜置換されてもよいアリアルオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリアルオキシ基、置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキルオキシ基、RaRbNー（ここでRaおよびRbは前記と同義である）、RcーLー（ここで、RcおよびLは前記と同義である。）、またはRx4Rx5C=NーOー（ここでRx4およびRx5は前記と同義である。）である式(1-u)で表される化合物を得る方法であって、式(1-g)で表される化合物とRyg-Qとを、塩基の存在下、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0846] 式(1-g)で表される化合物中、好ましいRycは、フッ素原子、塩素原子、または臭素原子である。

[0847] 本反応で使用されるRyg-Qは、市販品として入手または公知の方法で製造できる。好ましいQは、水素原子、またはナトリウム、カリウム等のアルカリ金属類である。

- [0848] 本反応で使用される $R_y g - Q$ の量は、式 $(1 - g)$ で表される化合物に対して 1 当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、1 当量以上 30 当量以下である。また、 Q が水素原子を表すときは、溶媒として使用することができる。
- [0849] 本反応に使用する塩基は、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、水素化ナトリウム等の無機塩基類が好ましい。また、 Q がアルカリ金属類のときは、塩基の使用は必須ではない。
- [0850] 本反応に使用する塩基の量は、式 $(1 - g)$ で表される化合物に対して 1 当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、1 当量以上 30 当量以下である。
- [0851] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、 $R_y g - H$ （式中、 $R_y g$ は前記と同義である。）で表されるアルコール系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル tert-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、アセトニトリル等のニトリル系溶媒、N-メチルピロリドン、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等のウレア系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の硫黄系溶媒、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または 2 種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。
- [0852] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式 $(1 - g)$ で表される化合物に対して 3 重量倍以上 200 重量倍以下である。
- [0853] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限

定されることはないが、通常、0℃以上150℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0854] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

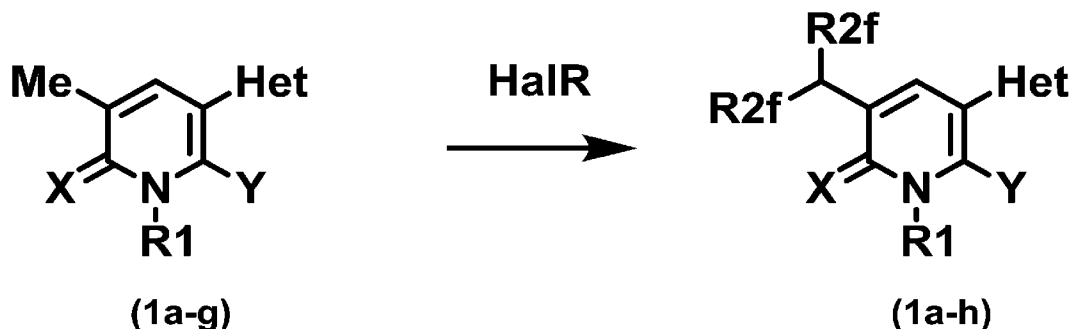
[0855] 前記で得られた式(1-u)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0856] 前記で得られた式(1-u)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0857] 溶媒留去後に得られた式(1-u)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0858] [製造方法AC]

[化112]



[0859] 式中、R 2 f はハロゲン原子を表し、H a l R、R 1、H e t、XおよびYは前記と同義である。

[0860] 製造方法A Cは、式(1 a)で表される化合物のうち、R 2 fがハロゲン原子である式(1 a-h)で表される化合物を得る方法であって、ラジカル開始剤とハロゲン化剤(H a l R)を用いて式(1 a-g)で表される化合物を溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0861] 式(1 a-h)中、好ましいR 2 fは、塩素原子、臭素原子、またはヨウ素原子である。

[0862] 本反応に使用するラジカル開始剤は、アゾビスイソブチロニトリル、2, 2'-アゾビス(4-メトキシ-2, 4-ジメチルバレロニトリル)、過酸化ベンゾイル等が挙げられる。

[0863] 本反応に使用するラジカル開始剤の量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(1 a-g)で表される化合物に対して0. 01当量以上1. 0当量以下である。

[0864] 本反応に使用するハロゲン化剤は、N-クロロスクシンイミド、N-ブロモスクシンイミド、N-ヨードスクシンイミド、1, 3-ジクロロ-5, 5-ジメチルヒダントイン、1, 3-ジブromo-5, 5-ジメチルヒダントイン、1, 3-ジヨード-5, 5-ジメチルヒダントイン等が挙げられる。

[0865] 本反応に使用するハロゲン化剤の量は、式(1 a-g)で表される化合物に対して2当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、2当量以上2. 8当量以下である。

- [0866] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化ベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。
- [0867] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(1a-g)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。
- [0868] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、20℃以上150℃以下または溶媒の沸点以下である。
- [0869] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、

目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

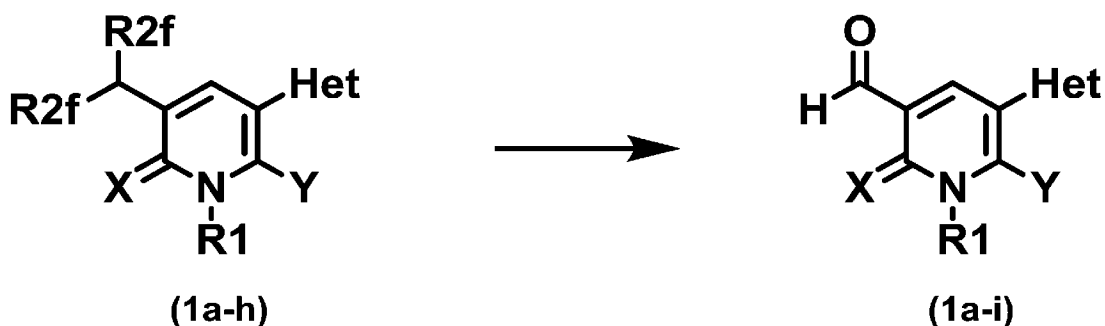
[0870] 前記で得られた式(1a-h)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0871] 前記で得られた式(1a-h)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0872] 溶媒留去後に得られた式(1a-h)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0873] [製造方法A D]

[化113]



[0874] 式中、R1、R2f、Het、XおよびYは前記と同義である。

[0875] 製造方法A Dは、式(1a)で表される化合物のうち、式(1a-i)で表される化合物を得る方法であって、水存在下、式(1a-h)で表される化合物を溶媒中で加水分解することを含む製造方法である。

[0876] 式(1a-h)中、好ましいR2fは、塩素原子、臭素原子、またはヨウ素原子である。

[0877] 本反応には、水が必須である。また、本反応を円滑に進行させるために、硝酸銀を使用することができる。

[0878] 本反応に使用する水の量は、式(1a-h)で表される化合物に対して1当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて限定されることは

ない。また、水は溶媒として使用することができる。

[0879] 本反応に使用する硝酸銀の量は、式（1 a – h）で表される化合物に対して2当量以上あれば、目的とする反応が進行する限りにおいて限定されることはなく、通常、2当量以上10当量以下である。

[0880] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、水溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル tert-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、アセトニトリル等のニトリル系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0881] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式（1 a – h）で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0882] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、 -10°C 以上 100°C 以下または溶媒の沸点以下である。

[0883] 反応の後処理としては、溶解していない金属類を濾過することにより除去することが可能である。さらに、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル tert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩

化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

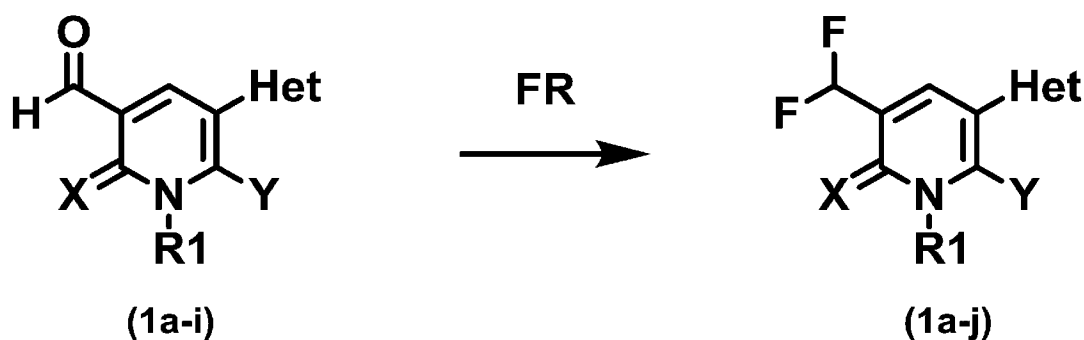
[0884] 前記で得られた式(1a-i)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0885] 前記で得られた式(1a-i)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0886] 溶媒留去後に得られた式(1a-i)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0887] [製造方法A E]

[化114]



[0888] 式中、FRはフッ素化剤を表し、R1、Het、XおよびYは前記と同義である。

[0889] 製造方法A Eは、式(1a)で表される化合物のうち、フッ素原子を有する式(1a-j)で表される化合物を得る方法であって、式(1a-i)で表される化合物とフッ素化剤(FR)とを、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

- [0890] 本反応に使用するフッ素化剤として、（ジエチルアミノ）サルファートリフルオリド、ビス（２－メトキシエチル）アミノサルファートリフルオリド、N，N－ジエチル－１，１，２，３，３，３－ヘキサフルオロプロピルアミン、２，２－ジフルオロ－１，３－ジメチルイミダゾリジン等が挙げられる。
- [0891] 本反応に使用するフッ素化剤の量は、式（１ a－i）で表される化合物に対して２当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、通常、２当量以上１０当量以下である。
- [0892] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル－ｔ－ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、アセトニトリル等のニトリル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または２種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。
- [0893] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式（１ a－i）で表される化合物に対して３重量倍以上２００重量倍以下である。
- [0894] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、－８０℃以上１００℃以下または溶媒の沸点以下である。
- [0895] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、

亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル-*t*-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

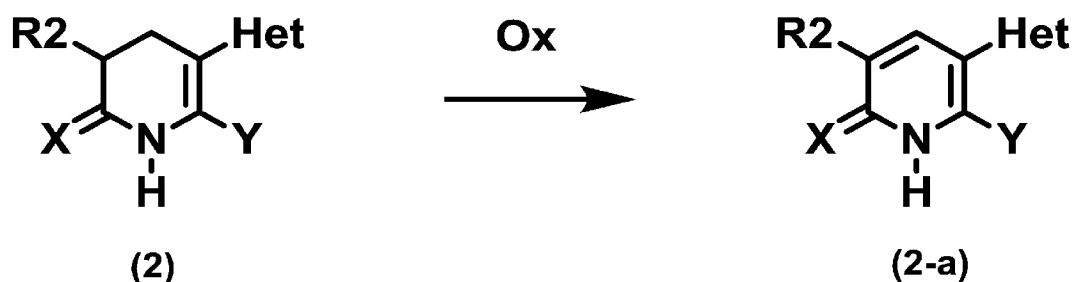
[0896] 前記で得られた式(1a-j)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0897] 前記で得られた式(1a-j)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0898] 溶媒留去後に得られた式(1a-j)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0899] [製造方法A F]

[化115]



[0900] 式中、Oxは酸化剤を表し、R2、Het、XおよびYは、前記と同義で

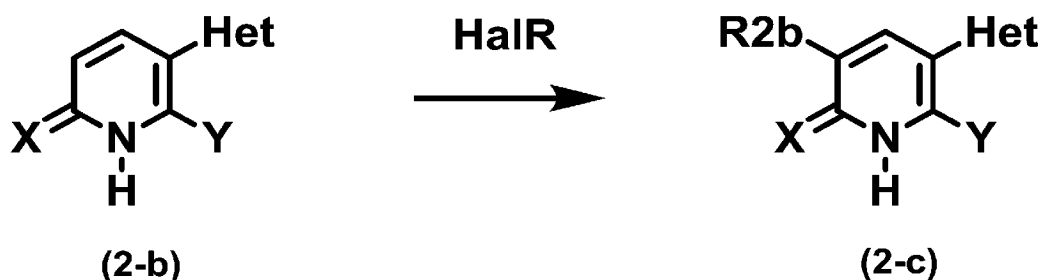
ある。

[0901] 製造方法A Fは、式(2-a)で表される化合物を得る方法であって、式(2)で表される化合物と酸化剤(Ox)とを、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0902] 製造方法Eにおける式(1b)で表される化合物を式(2)で表される化合物に代えて使用することにより、製造方法Eに準じて製造方法A Fを実施することができる。

[0903] [製造方法A G]

[化116]



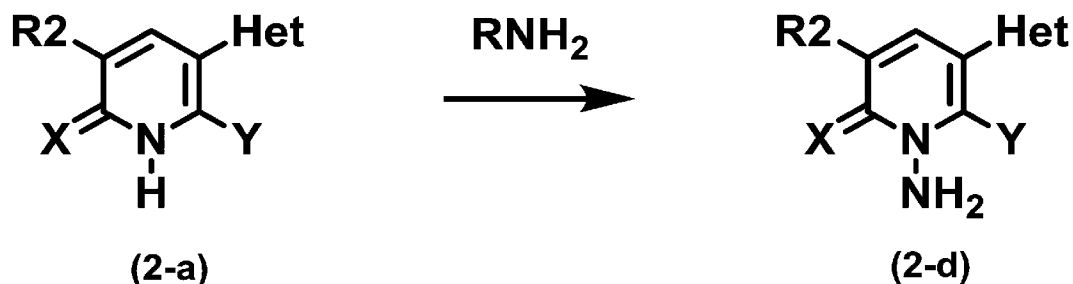
[0904] 式中、R2bはハロゲン原子を表し、HalRはハロゲン化剤を表し、Het、XおよびYは前記と同義である。

[0905] 製造方法A Gは、式(2-a)で表される化合物のうち、R2bがハロゲン原子を表す式(2-c)で表される化合物を得る製造方法であって、式(2-b)で表される化合物とハロゲン化剤(HalR)とを、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0906] 製造方法Fにおける式(1a-a)で表される化合物を式(2-b)で表される化合物に代えて使用することにより、製造方法Fに準じて製造方法A Gを実施することができる。

[0907] [製造方法A H]

[化117]



[0908] 式中、 RNH_2 はアミノ化剤を表し、 R_2 、 Het 、 X および Y は、前記と同義である。

[0909] 製造方法A Hは、式(2-d)で表される化合物を得る方法であって、式(2-a)で表される化合物とアミノ化剤(RNH_2)とを、塩基の存在下、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

本反応に使用するアミノ化剤として、ジフェニルホスフィンアミド、 O -(4-ニトロベンゾイル)ヒドロキシルアミン、 O -(2,4-ジニトロフェニル)-ヒドロキシルアミン、 O -(ジフェニルホスフィニル)ヒドロキシルアミン等が挙げられる。

[0910] 本反応に使用するアミノ化剤の量は、式(2-a)で表される化合物に対して1当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、通常、1当量以上5当量以下である。

[0911] 本反応に使用する塩基として、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、リン酸三カリウムのような無機塩基類やナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム t -ブトキシド等の金属アルコキシド類、水素化ナトリウム等の金属ヒドリド類、リチウムジイソプロピルアミド、ヘキサメチルジシラザンリチウム、ヘキサメチルジシラザンナトリウム、ヘキサメチルジシラザンカリウム等の金属アミド類が例示されるが、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはない。

[0912] 本反応に使用する塩基の量は、式(2-a)で表される化合物に対して1当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限され

ることではないが、好ましくは、1当量以上10当量以下である。

[0913] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル tert-ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、アセトニトリル等のニトリル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、N-メチルピロリドン、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等のウレア系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または2種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。

[0914] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式(2-a)で表される化合物に対して3重量倍以上200重量倍以下である。

[0915] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、-80℃以上100℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0916] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチル

エーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtertブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

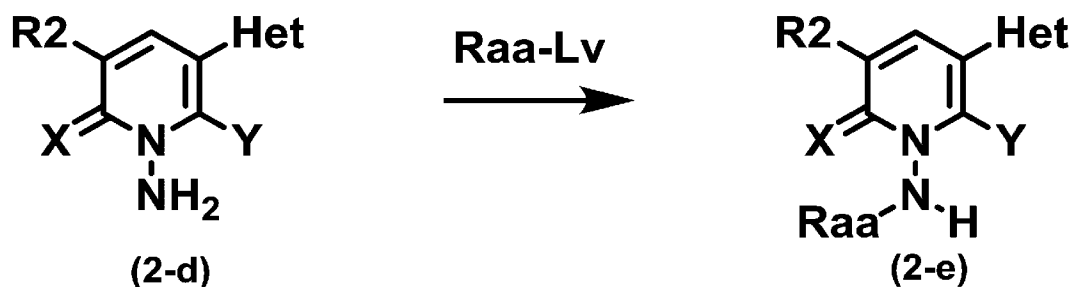
[0917] 前記で得られた式(2-d)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0918] 前記で得られた式(2-d)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0919] 溶媒留去後に得られた式(2-d)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0920] [製造方法A1]

[化118]



[0921] 式中、Raaは置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、またはC3～C8のシクロアルキル基を表し、R2、Het、Lv、XおよびYは、前記と同義である。

[0922] 製造方法A1は、式(2-e)で表される化合物を得る方法であって、式(2-d)で表される化合物とRaa-Lvとを、塩基の存在下、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

- [0923] 本反応に使用する R a a - L v は、市販品として入手または公知の方法で製造することができる。
- [0924] 本反応に使用する R a a - L v の量は、式（2 - d）で表される化合物に対して 1 当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、1 当量以上 10 当量以下である。
- [0925] 本反応に使用する塩基として、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、水素化ナトリウム等の無機塩基類が例示されるが、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはない。
- [0926] 本反応に使用する塩基の量は、式（2 - d）で表される化合物に対して 1 当量以上あればよく、目的とする反応が進行する限りにおいて特に制限されることはないが、好ましくは、1 当量以上 10 当量以下である。
- [0927] 本反応に使用する溶媒は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル tert - ブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、アセトニトリル等のニトリル系溶媒、N - メチルピロリドン、N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒、1, 3 - ジメチルー 2 - イミダゾリジノン等のウレア系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の硫黄系溶媒、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン系溶媒、および水溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、単独または 2 種類以上を任意の割合で混合して使用することができる。
- [0928] 本反応に使用する溶媒量は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、式（2 - d）で表される化合物に対して 3

重量倍以上200重量倍以下である。

[0929] 本反応を行う際の温度は、目的とする反応が進行する限りにおいて特に限定されることはないが、通常、0℃以上150℃以下または溶媒の沸点以下である。

[0930] 反応の後処理としては、反応混合物に対して、水または適当な水溶液を加えることにより、分液操作を行うことが可能である。水溶液を使用する場合は、塩酸、硫酸、塩化アンモニウム等を溶解した酸性水溶液、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を溶解したアルカリ水溶液、チオ硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム等の硫黄原子を含む塩を溶解した水溶液や食塩水等を任意に使用することができる。分液操作の際に、必要に応じて、トルエン、キシレン、ベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のベンゼン系溶媒、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸ブチル等のエステル系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル等のエーテル系溶媒、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン等の炭化水素系溶媒等の水と相溶することのない溶媒を追加することが可能である。また、これらの溶媒は、単独で使用することも、2種類以上で任意の割合で混合することも可能である。分液の回数は特に制限されることがなく、目的とする純度や収量に応じて実施することができる。

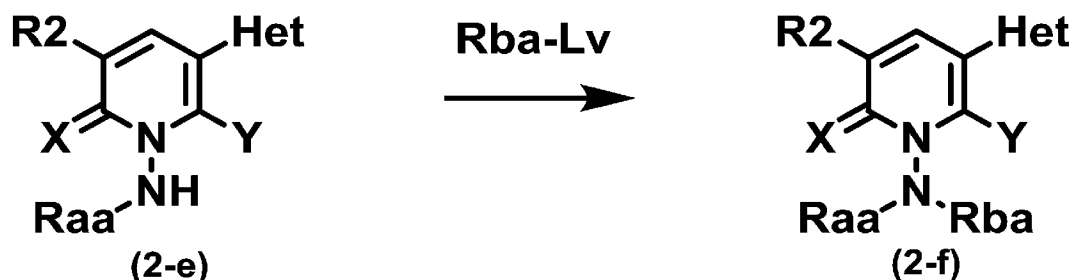
[0931] 前記で得られた式(2-e)で表される化合物を含む反応混合物は、硫酸ナトリウムや硫酸マグネシウム等の乾燥剤で水分を除去することができるが、必須ではない。

[0932] 前記で得られた式(2-e)で表される化合物を含む反応混合物は、化合物が分解しない限りにおいて、減圧下で溶媒留去することが可能である。

[0933] 溶媒留去後に得られた式(2-e)で表される化合物を含む反応混合物は、適当な溶媒により、洗浄、再沈殿、再結晶、カラムクロマトグラフィー等にて精製することができる。目的とする純度に応じて適宜設定すればよい。

[0934] [製造方法 A J]

[化119]



[0935] 式中、R b aは置換基Bで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、またはC 3～C 8のシクロアルキル基を表し、R 2、H e t、L v、XおよびYは、前記と同義である。

[0936] 製造方法 A Jは、式（2－f）で表される化合物を得る方法であって、式（2－e）で表される化合物とR b a－L vとを、塩基の存在下、溶媒中で反応させることを含む製造方法である。

[0937] 本反応に使用するR b a－L vは、市販品として入手または公知の方法で製造することができる。

[0938] 製造方法 A Iにおける式（2－d）で表される化合物を式（2－e）で表される化合物に代えて使用することにより、製造方法 A Iに準じて製造方法 A Jを実施することができる。また、R a aとR b aが同一である場合、製造方法 A Iにおける式（2－d）に対して、2当量以上のR a a－L vを使用することにより、式（2－f）で表される化合物を合成することができる。

[0939] 以上に示した、製造方法 A～製造方法 A Jを任意に組み合わせて、式（1）で表される化合物を製造することができる。もしくは、公知の方法と製造方法 A～製造方法 A Jを任意に組み合わせても、式（1）で表される化合物を製造することができる。

[0940] 本発明化合物は、植物に対して有害な生物を防除するために、農薬として使用することができる。具体的には、殺菌剤、殺虫剤、除草剤、植物成長調整剤等が挙げられる。好ましくは、殺菌剤である。

- [0941] 本発明化合物は、植物病害の防除のために、畑地、水田、茶園、果樹園、牧草地、芝生、森林、庭園、街路樹等で農園芸用殺菌剤として使用することができる。
- [0942] 本発明でいう植物病害とは、農作物、花き、花木、樹木等の植物に萎ちょう、立枯れ、黄化、萎縮、徒長等の全身的な異常な病的症状、または斑点、葉枯れ、モザイク、葉巻、枝枯れ、根腐れ、根こぶ、こぶ等の部分的な病的症状が惹起されることである。即ち、植物が病気になることである。植物病害を引き起こす病原体として、主に、菌類、細菌、スピロプラズマ、ファイトプラズマ、ウイルス、ウイロイド、寄生性高等植物、線虫等が挙げられる。本発明化合物は菌類に有効であるが、これに限定されるものではない。
- [0943] 菌類によって引き起こされる病害は、主に菌類病である。菌類病を引き起こす菌類（病原体）として、ネコブカビ菌類、卵菌類、接合菌類、子のう菌類、担子菌類および不完全菌類等が挙げられる。例えば、ネコブカビ菌類として、根こぶ病菌、ジャカイモ粉状そうか病菌、テンサイそう根病菌、卵菌類として疫病菌、べと病菌、*Pythium*属菌、*Aphanomyces*属菌、接合菌類として*Rhizopus*属菌、子のう菌類としてモモ縮葉病菌、トウモロコシごま葉枯病菌、イネいもち病菌、うどんこ病菌、炭そ病菌、赤かび病菌、ばか苗病菌、菌核病菌、担子菌類としてさび病菌類、黒穂病菌類、紫紋羽病菌、もち病菌、紋枯病菌、不完全菌類として灰色かび病菌、*Alternaria*属菌、*Fusarium*属菌、*Penicillium*属菌、*Rhizoctonia*属菌、白絹病菌等が挙げられる。
- [0944] 本発明化合物は、各種の植物病害に対して有効である。以下に、病害名およびその病原菌名の具体例を示す。
- [0945] イネのいもち病 (*Magnaporthe grisea*)、紋枯病 (*Thanatephorus cucumeris*)、褐色菌核病 (*Ceratobasidium setariae*)、褐色小粒菌核病 (*Waitea circinata*)、褐色紋枯病 (*Thanatephorus cucumeris*)、球状菌核病 (*Sclerotium hydroph*

illum)、赤色菌核病 (*Wairea circinata*)、黒しゅ病 (*Entyloma dactylidis*)、小球菌核病 (*Magnaporthe salvinii*)、灰色菌核病 (*Ceratobasidium cornigerum*)、ごま葉枯病 (*Cochliobolus miyabeanus*)、条葉枯病 (*Sphaerulina oryzae*)、ばか苗病 (*Gibberella fujikuroi*)、苗立枯病 (*Pythium* spp.、*Fusarium* spp.、*Trichoderma* spp.、*Rhizopus* spp.、*Rhizoctonia solani*、*Mucor* sp.、*Phoma* sp.)、苗腐病 (*Pythium* spp.、*Achlya* spp.、*Dictyuchus* spp.)、稲こうじ病 (*Claviceps virens*)、墨黒穂病 (*Tilletia barclayana*)、褐色米 (*Curvularia* spp.、*Alternaria* spp.)、黄化萎縮病 (*Sclerophthora macrospora*)、白葉枯病 (*Xanthomonas oryzae* pv. *oryzae*)、褐条病 (*Acidovorax avenae* subsp. *avenae*)、内頤褐変病 (*Erwinia ananas*)、苗立枯細菌病 (*Burkholderia plantarii*)、もみ枯細菌病 (*Burkholderia glumae*)、葉鞘褐変病 (*Pseudomonas fuscovaginae*)、かさ枯病 (*Pseudomonas syringae* pv. *oryzae*)、株腐病 (*Erwinia chrysanthemi*)、黄萎病 (*Phytoplasma oryzae*)、縞葉枯病 (*Rice stripe tenuivirus*)、萎縮病 (*Rice dwarf reovirus*) ;

ムギ類のうどんこ病 (*Blumeria graminis* f. sp. *hordei*; f. sp. *tritici*)、さび病 (*Puccinia striiformis*、*Puccinia graminis*、*Puccinia recondita*、*Puccinia hordei*)、斑

葉病 (*Pyrenophora graminea*)、網斑病 (*Pyrenophora teres*)、赤かび病 (*Gibberella zeae*、*Fusarium culmorum*、*Fusarium avenaceum*、*Monographella nivalis*)、雪腐病 (*Typhula incarnata*、*Typhula ishikariensis*、*Monographella nivalis*)、裸黒穂病 (*Ustilago nuda*)、なまぐさ黒穂病 (*Tilletia caries*、*Tilletia controversa*)、眼紋病 (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、株腐病 (*Ceratobasidium gramineum*)、雲形病 (*Rhynchosporium secalis*)、葉枯病 (*Septoria tritici*)、心枯病 (*Phaeosphaeria nodorum*)、苗立枯病 (*Fusarium* spp.、*Pythium* spp.、*Rhizoctonia* spp.、*Septoria* spp.、*Pyrenophora* spp.)、立枯病 (*Gaeumannomyces graminis*)、炭疽病 (*Colletotrichum graminicola*)、麦角病 (*Claviceps purpurea*)、斑点病 (*Cochliobolus sativus*)、黒節病 (*Pseudomonas syringae* pv. *syringae*)；

トウモロコシの赤かび病 (*Gibberella zeae*等)、苗立枯病 (*Fusarium avenaceum*、*Penicillium* spp.、*Pythium* spp.、*Rhizoctonia* spp.)、さび病 (*Puccinia sorghi*)、ごま葉枯病 (*Cochliobolus heterostrophus*)、黒穂病 (*Ustilago maydis*)、炭疽病 (*Colletotrichum graminicola*)、北方斑点病 (*Cochliobolus carbonum*)、褐条病 (*Acidovorax avenae* subsp. *avenae*)、条斑細菌病 (*Burkholderia andropogon*

is)、倒伏細菌病 (*Erwinia chrysanthemi* pv. *zeae*)、萎ちょう細菌病 (*Erwinia stewartii*) ; ブドウのべと病 (*Plasmopara viticola*)、さび病 (*Phytophthora ampelopsidis*)、うどんこ病 (*Uncinula necator*)、黒とう病 (*Elsinoe ampelina*)、晩腐病 (*Glomerella cingulata*、*Colletotrichum acutatum*)、黒腐病 (*Guignardia bidwellii*)、つる割病 (*Phomopsis viticola*)、すす点病 (*Zygophiala jamaicensis*)、灰色かび病 (*Botrytis cinerea*)、芽枯病 (*Diaporthe medusaea*)、紫紋羽病 (*Helicobasidium mompa*)、白紋羽病 (*Rosellinia necatrix*)、根頭がんしゅ病 (*Agrobacterium vitis*) ; リンゴのうどんこ病 (*Podosphaera leucotricha*)、黒星病 (*Venturia inaequalis*)、斑点落葉病 (*Alternaria mali*)、赤星病 (*Gymnosporangium yamadae*)、モニリア病 (*Monilinia mali*)、腐らん病 (*Valsa ceratosperma*)、輪紋病 (*Botryosphaeria berengeriana*)、炭疽病 (*Colletotrichum acutatum*、*Glomerella cingulata*)、すす点病 (*Zygophiala jamaicensis*)、すす斑病 (*Gloeodes pomigena*)、黒点病 (*Mycosphaerella pomi*)、紫紋羽病 (*Helicobasidium mompa*)、白紋羽病 (*Rosellinia necatrix*)、胴枯病 (*Phomopsis mali*、*Diaporthe tanakae*)、褐斑病 (*Diplocarpon mali*)、リンゴの火傷病 (*Erwinia amylovora*)、根頭がんしゅ病 (*Agrobacterium tumefaciens*)、毛根病 (*Agrobacterium rhizog*

enes) ;

ナシの黒斑病 (*Alternaria kikuchiana*)、黒星病 (*Venturia nashicola*)、赤星病 (*Gymnosporangium asiaticum*)、輪紋病 (*Botryosphaeria berengeriana* f. sp. *piricola*)、胴枯病 (*Phomopsis fukushii*)、枝枯細菌病 (*Erwinia* sp.)、根頭がんしゅ病 (*Agrobacterium tumefaciens*)、さび色胴枯病 (*Erwinia chrysanthemi* pv. *chrysanthemi*)、花腐細菌病 (*Pseudomonas syringae* pv. *syringae*) ; セイヨウナシの疫病 (*Phytophthora cactorum*、*Phytophthora syringae*)、枝枯細菌病 (*Erwinia* sp.) ; モモの黒星病 (*Cladosporium carpophilum*)、ホモブシス腐敗病 (*Phomopsis* sp.)、疫病 (*Phytophthora* sp.)、炭疽病 (*Colletotrichum gloeosporioides*)、縮葉病 (*Taphrina deformans*)、穿孔細菌病 (*Xanthomonas campestris* pv. *pruni*)、根頭がんしゅ病 (*Agrobacterium tumefaciens*) ; オウトウの炭疽病 (*Glomerella cingulata*)、幼果菌核病 (*Monilinia kusanoi*)、灰星病 (*Monilinia fructicola*)、根頭がんしゅ病 (*Agrobacterium tumefaciens*)、樹脂細菌病 (*Pseudomonas syringae* pv. *syringae*) ; カキの炭疽病 (*Glomerella cingulata*)、落葉病 (*Cercospora kaki*; *Mycosphaerella nawae*)、うどんこ病 (*Phyllactinia kakikora*)、根頭がんしゅ病 (*Agrobacterium tumefaciens*) ; カンキツの黒点病 (*Diaporthe citri*)、緑かび病 (*Penicil*

lium digitatum)、青かび病 (*Penicillium italicum*)、そうか病 (*Elsinoe fawcettii*)、褐色腐敗病 (*Phytophthora citrophthora*)、かいよう病 (*Xanthomonas campestris* pv. *citri*)、褐斑細菌病 (*Pseudomonas syringae* pv. *syringae*)、グリーニング病 (*Liberibacter asiaticus*)、根頭がんしゅ病 (*Agrobacterium tumefaciens*) ;

トマト、キュウリ、豆類、イチゴ、ジャガイモ、キャベツ、ナス、レタス等の灰色かび病 (*Botrytis cinerea*) ; トマト、キュウリ、豆類、イチゴ、ジャガイモ、ナタネ、キャベツ、ナス、レタス等の菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) ; トマト、キュウリ、豆類、ダイコン、スイカ、ナス、ナタネ、ピーマン、ハウレンソウ、テンサイ等各種野菜の苗立枯病 (*Rhizoctonia* spp.、*Pythium* spp.、*Fusarium* spp.、*Phytophthora* spp.、*Sclerotinia sclerotiorum*等) ; ナス科植物の青枯病 (*Ralstonia solanacearum*) ; ウリ類のべと病 (*Pseudoperonospora cubensis*)、うどんこ病 (*Sphaerotheca fuliginea*)、炭疽病 (*Colletotrichum orbiculare*)、つる枯病 (*Didymella bryoniae*)、つる割病 (*Fusarium oxysporum*)、疫病 (*Phytophthora parasitica*、*Phytophthora melonis*、*Phytophthora nicotianae*、*Phytophthora drechsleri*、*Phytophthora capsici*等)、褐斑細菌病 (*Xanthomonas campestris* pv. *cucurbitae*)、軟腐病 (*Erwinia carotovora* subsp. *carotovora*)、斑点細菌病 (*Pseudomonas sy*

ringae pv. *lachrymans*)、縁枯細菌病 (*Pseudomonas marginalis* pv. *marginalis*)、がんしゅ病 (*Streptomyces* sp.)、毛根病 (*Agrobacterium rhizogenes*)、キュウリモザイクウイルス (*Cucumber mosaic virus*) ;

トマトの輪紋病 (*Alternaria solani*)、葉かび病 (*Fulvia fulva*)、疫病 (*Phytophthora infestans*)、萎凋病 (*Fusarium oxysporum*)、根腐病 (*Pythium myriotylum*、*Pythium dissotocum*)、炭疽病 (*Colletotrichum gloeosporioides*)、かいよう病 (*Clavibacter michiganensis*)、茎えそ細菌病 (*Pseudomonas corrugata*)、黒斑細菌病 (*Pseudomonas viridiflava*)、軟腐病 (*Erwinia carotovora* subsp. *carotovora*)、葉こぶ病 (*Crynebacterium* sp.)、萎黄病 (*Phytoplasma asteris*)、黄化萎縮病 (*Tobacco leaf curl subgroup III geminivirus*) ; ナスのうどんこ病 (*Sphaerotheca fuliginea* 等)、すすかび病 (*Mycovellosiella nattrassii*)、疫病 (*Phytophthora infestans*)、褐色腐敗病 (*Phytophthora capsici*)、褐斑細菌病 (*Pseudomonas cichorii*)、茎えそ細菌病 (*Pseudomonas corrugata*)、茎腐細菌病 (*Erwinia chrysanthemi*)、軟腐病 (*Erwinia carotovora* subsp. *carotovora*)、斑点細菌病 (*Pseudomonas* sp.) ; ナタネの黒斑病 (*Alternaria brassicae*)、黒腐病 (*Xanthomonas campestris* pv. *campestris*)、黒斑細菌病 (*Pseudomonas syri*

ngae pv. maculicola)、軟腐病 (*Erwinia carotovora*) ; アブラナ科野菜の黒斑病 (*Alternaria brassicae* 等)、白斑病 (*Cercospora brassicae*)、根朽病 (*Phoma lingam*)、根こぶ病 (*Plasmodiophora brassicae*)、べと病 (*Peronospora parasitica*)、黒腐病 (*Xanthomonas campestris* pv. *campestris*)、黒斑細菌病 (*Pseudomonas syringae* pv. *maculicola*)、軟腐病 (*Erwinia carotovora* subsp. *carotovora*) ;

キャベツの株腐病 (*Thanatephorus cucumeris*)、萎黄病 (*Fusarium oxysporum*)、黒すす病 (*Alternaria brassisicola*) ; ハクサイの尻腐病 (*Rhizoctonia solani*)、黄化病 (*Verticillium dahliae*) ; ネギのさび病 (*Puccinia allii*)、黒斑病 (*Alternaria porri*)、白絹病 (*Sclerotium rolfsii*)、白色疫病 (*Phytophthora porri*)、黒腐菌核病 (*Sclerotium cepivorum*) ; タマネギのかいよう病 (*Curtobacterium flaccumfaciens*)、軟腐病 (*Erwinia carotovora* subsp. *carotovora*)、斑点細菌病 (*Pseudomonas syringae* pv. *syringae*)、腐敗病 (*Erwinia rhapontici*)、鱗片腐敗病 (*Burkholderia gladioli*)、萎黄病 (*Phytoplasma asteris*) ; ニンニクの軟腐病 (*Erwinia carotovora* subsp. *carotovora*)、春腐病 (*Pseudomonas marginalis* pv. *marginalis*) ; ダイズの紫斑病 (*Cercospora kikuchii*)、黒とう病 (*Elsinoe glycines*)、黒点病

(*Diaporthe phaseolorum*)、リゾクトニア根腐病 (*Rhizoctonia solani*)、茎疫病 (*Phytophthora sojae*)、べと病 (*Peronospora manshurica*)、さび病 (*Phakopsora pachyrhizi*)、炭疽病 (*Colletotrichum truncatum*等)、葉焼病 (*Xanthomonas campestris* pv. *glycines*)、斑点細菌病 (*Pseudomonas syringae* pv. *glycinea*) ; インゲンの炭疽病 (*Colletotrichum lindemuthianum*)、青枯病 (*Ralstonia solanacearum*)、かさ枯病 (*Pseudomonas syringae* pv. *phaseolicola*)、褐斑細菌病 (*Pseudomonas viridiflava*)、葉焼病 (*Xanthomonas campestris* pv. *phaseoli*) ;

ラッカセイの黒渋病 (*Mycosphaerella berkeleyi*)、褐斑病 (*Mycosphaerella arachidis*)、青枯病 (*Ralstonia solanacearum*) ; エンドウのうどんこ病 (*Erysiphe pisi*)、べと病 (*Peronospora pisi*)、つる枯細菌病 (*Pseudomonas syringae* pv. *pisii*)、つる腐細菌病 (*Xanthomonas campestris* pv. *pisii*) ; ソラマメのべと病 (*Peronospora viciae*)、疫病 (*Phytophthora nicotianae*) ; ジャガイモの夏疫病 (*Alternaria solani*)、黒あざ病 (*Thanatephorus cucumeris*)、疫病 (*Phytophthora infestans*)、銀か病 (*Helminthosporium solani*)、乾腐病 (*Fusarium oxysporum*、*Fusarium solani*)、粉状そうか病 (*Spongospora subterranea*)、青枯病 (*Ralstonia solanacearum*)、黒あし病 (*Erwinia carotov*

ora subsp. atroseptica)、そうか病 (Streptomyces scabies、Streptomyces acidiscabies)、軟腐病 (Erwinia carotovora subsp. carotovora)、粘性腐敗病 (Crostridium spp.)、輪腐病 (Clavibacter michiganensis subsp. sepedonicus) ; サツマイモの立枯病 (Streptomyces ipomoeae) ; テンサイの褐斑病 (Cercospora beticola)、べと病 (Peronospora schachtii)、黒根病 (Aphanomyces cohioides)、蛇の目病 (Phoma betae)、根頭がんしゅ病 (Agrobacterium tumefaciens)、そうか病 (Streptomyces scabies)、斑点細菌病 (Pseudomonas syringae pv. aptata) ;

ニンジンの黒葉枯病 (Alternaria dauci)、こぶ病 (Rhizobacter dauci)、根頭がんしゅ病 (Agrobacterium tumefaciens)、ストレプトミセスそうか病 (Streptomyces spp.)、軟腐病 (Erwinia carotovora subsp. carotovora) ; イチゴのうどんこ病 (Sphaerotheca aphaniis var. aphaniis)、疫病 (Phytophthora nicotianae等)、炭疽病 (Glomerella cingulata等)、果実腐敗病 (Pythium ultimum)、青枯病 (Ralstonia solanacearum)、角斑細菌病 (Xanthomonas campestris)、芽枯細菌病 (Pseudomonas marginalis pv. marginalis) ; チャの網もち病 (Exobasidium reticulatum)、白星病 (Elsinoe leucospila)、炭疽病 (Colletotrichum theae-sinensis)、輪斑病 (Pestalotiopsis longiseta)、

赤焼病 (*Pseudomonas syringae* pv. *theae*)、かいよう病 (*Xanthomonas campestris* pv. *theicola*)、てんぐ巢病 (*Pseudomonas* sp.) ; タバコの赤星病 (*Alternaria alternata*)、うどんこ病 (*Erysiphe cichoracearum*)、炭疽病 (*Colletotrichum gloeosporioides*)、疫病 (*Phytophthora nicotianae*)、野火病 (*Pseudomonas syringae* pv. *tabaci*)、黄がさ細菌病 (*Pseudomonas syringae* pv. *mellea*)、空洞病 (*Erwinia carotovora* subsp. *carotovora*)、立枯病 (*Ralstonia solanacearum*)、タバコモザイクウイルス (*Tobacco mosaic virus*) ; コーヒーのさび病 (*Hemileia vastatrix*) ; バナナの黒シガトガ病 (*Mycosphaerella fijiensis*)、パナマ病 (*Fusarium oxysporum* f. sp. *cubense*) ; ワタの立枯病 (*Fusarium oxysporum*)、白かび病 (*Ramularia areola*) ; ヒマワリの菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*)、角点病 (*Xanthomonas campestris* pv. *malvacearum*)、空洞病 (*Erwinia carotovora* subsp. *carotovora*)、斑点細菌病 (*Pseudomonas syringae* pv. *helianthi*) ; バラの黒星病 (*Diplocarpon rosae*)、うどんこ病 (*Sphaerotheca pannosa* 等)、疫病 (*Phytophthora megasperma*)、べと病 (*Peronospora sparsa*)、根頭がんしゅ病 (*Agrobacterium tumefaciens*) ; キクの褐斑病 (*Septoria obesa*)、白さび病 (*Puccinia horiana*)、疫病 (*Phytophthora cactorum*)、斑点細菌病 (*Pseudomo*

nas cichorii)、軟腐病 (*Erwinia carotovora* subsp. *carotovora*)、根頭がんしゅ病 (*Agrobacterium tumefaciens*)、毛根病 (*Agrobacterium rhizogenes*)、緑化病 (*Phytoplasma aurantifolia*)；芝のブラウンパッチ病 (*Rhizoctonia solani*)、ダラスポット病 (*Sclerotinia homoeocarpa*)、カーブラリア葉枯病 (*Curvularia* sp.)、さび病 (*Puccinia zoysiae*)、ヘルミントスポリウム葉枯病 (*Cochliobolus* sp.)、雲形病 (*Rhynchosporium secalis*)、立枯病 (*Gaeumannomyces graminis*)、炭疽病 (*Colletotrichum* sp.)、雪腐褐色小粒菌核病 (*Typhula incarnata*)、雪腐黒色小粒菌核病 (*Typhula ishikariensis*)、雪腐大粒菌核病 (*Myriosclerotinia borealis*)、フェアリーリング病 (*Marasmius oreades*等)、ピシウム病 (*Pythium aphanidermatum*等)、いもち病 (*Pyricularia grisea*)等が挙げられる。

[0946] 本発明化合物は、本化合物単体で使用してもよいが、好ましくは、固体担体、液体担体、気体担体、界面活性剤、固着剤、分散剤、安定剤等と混合し、粉剤、水和剤、顆粒水和剤、水溶剤、顆粒水溶剤、粒剤、乳剤、液剤、マイクロエマルジョン剤、水性懸濁剤、水性乳濁剤、サスポエマルジョン剤等の組成物として使用することができる。効果が発揮される限りにおいて、それらの組成物に限定されることはない。

[0947] 以下に具体的な製剤化例を示すが、これらに限定されるものではない。

[0948] [製剤例1 フロアブル剤]

本発明化合物 (10質量部)、ナフタレンスルホン酸のホルムアルデヒド縮合物ナトリウム塩 (5質量部)、ポリオキシエチレンアリールフェニルエーテル (1質量部)、プロピレングリコール (5質量部)、シリコン系消泡

剤（０．１質量部）、キサンタンガム（０．２質量部）、イオン交換水（７８．７質量部）を混合してスラリーとなし、さらにダイノミルＫＤＬで直径１．０ｍｍのガラスビーズを用いて湿式粉碎しフロアブル剤を得る。

[0949] [製剤例２ 乳剤]

本発明化合物（５質量部）をキシレン（４０質量部）とシクロヘキサン（３５質量部）の混合溶液に溶解し、この溶液にＴｗｅｅｎ２０（２０質量部）を添加混合し、乳剤を得る。

[0950] [製剤例３ 水和剤]

本発明化合物（１０質量部）、ホワイトカーボン（１０質量部）、ポリビニルアルコール（２質量部）、ジオクチルスルホコハク酸ナトリウム塩（０．５質量部）、アルキルベンゼンスルホン酸ナトリウム塩（５質量部）、焼成珪藻土（１０質量部）およびカオリナイトクレー（６２．５質量部）を充分に混合し、エアーミルで粉碎し、水和剤を得る。

[0951] 以下、本発明の組成物（農園芸用有害生物防除剤、農園芸用殺菌剤）の施用について説明する。

[0952] 本発明化合物を含有する組成物の施用方法としては、植物体もしくは種子と接触させる方法、または、栽培土壤に含有させて、植物の根もしくは地下茎に接触させる方法が挙げられる。具体例として、組成物の植物個体への茎葉散布処理、注入処理、苗箱処理、セルトレー処理、植物種子への吹き付け処理、植物種子への塗沫処理、植物種子への浸漬処理、植物種子への粉衣処理、土壤表面への散布処理、土壤表面への散布処理後の土壤混和、土壤中への注入処理、土壤中での注入処理後の土壤混和、土壤灌注処理、土壤灌注処理後の土壤混和等が挙げられる。通常、当業者が利用するようないかなる施用方法を用いても十分な効力を発揮する。

[0953] 本発明でいう「植物」とは、光合成をして運動せずに生活するものをいう。具体例として、稲、小麦、大麦、トウモロコシ、コーヒー、バナナ、ブドウ、リンゴ、ナシ、モモ、オウトウ、カキ、カンキツ、大豆、インゲン、ワタ、イチゴ、ジャガイモ、キャベツ、レタス、トマト、キュウリ、ナス、ス

イカ、テンサイ、ハウレンソウ、サヤエンドウ、カボチャ、サトウキビ、タバコ、ピーマン、サツマイモ、サトイモ、コンニャク、綿、ヒマワリ、バラ、チューリップ、キク、芝等およびそれらのF1品種等が挙げられる。また、遺伝子等を人工的に操作することにより生み出され、元来自然界に存在するものではない遺伝子組み換え作物も含み、例えば、除草剤耐性を付与した大豆、トウモロコシ、綿等、寒冷地適応したイネ、タバコ等、殺虫物質生産能を付与したトウモロコシ、綿等の農園芸作物等が挙げられる。さらに、マツ、トネリコ、イチョウ、カエデ、カシ、ポプラ、ケヤキ等の樹木等が挙げられる。また、本発明でいう「植物体」とは、前記の植物個体を構成する全ての部位を総称するものであり、例えば、茎、葉、根、種子、花、果実等が挙げられる。

[0954] 本発明でいう「種子」とは、幼植物が発芽するための栄養分を蓄え、農業上繁殖に用いられるものをいう。具体例として、トウモロコシ、大豆、綿、稲、テンサイ、小麦、大麦、ヒマワリ、トマト、キュウリ、ナス、ハウレンソウ、サヤエンドウ、カボチャ、サトウキビ、タバコ、ピーマン、セイヨウアブラナ等の種子、それらのF1品種等の種子、サトイモ、ジャガイモ、サツマイモ、コンニャク等の種芋、食用ゆり、チューリップ等の球根、ラッキョウ等の種球、および遺伝子組み換え作物の種子ならびに塊茎等が挙げられる。

[0955] 本発明化合物を含有する組成物の施用量および施用濃度は、対象作物、対象病害、病害の発生程度、化合物の剤型、施用方法および各種環境条件等によって変動するが、散布または灌注する場合には、有効成分量としてヘクタール当たり0.1～10,000gが適当であり、好ましくは、ヘクタール当たり10～1,000gである。また、種子処理の場合の使用量は、有効成分量として種子1kg当たり0.0001～1000gであり、好ましくは、0.001～100gである。本発明化合物を含有する組成物を植物個体への茎葉散布処理、土壌表面への散布処理、土壌中への注入処理または土壌灌注処理として使用する場合は、適当な担体に適当な濃度で希釈した後、処

理を行ってもよい。本発明化合物を含有する組成物を植物種子に接触させる場合は、適当な濃度に希釈した後、植物種子に浸漬、粉衣、吹き付けまたは塗沫処理して用いてもよい。浸漬、粉衣、吹き付けまたは塗沫処理する場合の組成物使用量は、通常、有効成分量として、乾燥植物種子重量の0.05～50%程度であり、好ましくは、0.1～30%が適当であるが、組成物の形態や処理対象となる植物種子の種類により適宜設定すればよく、これら範囲に限定されるものではない。

[0956] 本発明化合物を含有する組成物は、必要に応じて他の農薬、例えば、殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤、生物農薬および植物成長調節剤等の農薬、核酸を有効成分とする病害防除剤（国際公開第2014/062775号）、土壌改良剤または肥効物質と混合して使用することができる。本発明化合物と他の農薬を混合して使用する方法としては、本発明化合物と他の農薬とを一つの剤型に製剤化して使用する方法、それぞれが別々の剤型に製剤化された両者を使用前に混合して使用する方法、それぞれが別々の剤型に製剤化された両者を同時に使用する方法、または、それぞれが別々の剤型に製剤化された両者について、いずれか一方を使用した後に他方を使用する方法が挙げられる。

[0957] 本発明化合物と混合して使用することができる殺菌剤に含まれる具体的な成分は、以下の群bで例示され、これらの塩、異性体およびN-オキシド体を含む。ただし、公知の殺菌剤はこれらに限定されるものではない。

[0958] 群b：

b-1：フェニルアミド系殺菌剤

フェニルアミド系殺菌剤として、[b-1.1]：ベナラキシル (benalaxyl)、[b-1.2] ベナラキシルMまたはキララキシル (benalaxyl-Mまたはkiralaxyl)、[b-1.3] フララキシル (furalaxyl)、[b-1.4] メタラキシル (metalaxyl)、[b-1.5] メタラキシルMまたはメフェノキサム (metalaxyl-Mまたはmefenoxam)、[b-1.6] オキサジキシ

ル (oxadixyl)、[b-1. 7] オフラセ (ofurace) 等が挙げられる。

[0959] b-2：有糸核分裂および細胞分裂阻害剤

有糸核分裂および細胞分裂阻害剤として、[b-2. 1] ベノミル (benomy l)、[b-2. 2] カルベンダジム (carbendazim)、[b-2. 3] フベリダゾール (fuberidazole)、[b-2. 4] チアベンダゾール (thiabendazole)、[b-2. 5] チオファネート (thiophanate)、[b-2. 6] チオファネートメチル (thiophanate-methyl)、[b-2. 7] ジエトフェンカルブ (diethofencarb)、[b-2. 8] ゾキサミド (zoxamide)、[b-2. 9] エタボキサム (ethaboxam)、[b-2. 10] ペンシクロン (pencycuron)、[b-2. 11] フルオピコリド (fluopicolide)、[b-2. 12] フェナマクリル (phenamacril) 等が挙げられる。

[0960] b-3：コハク酸脱水素酵素阻害剤 (SDHI 剤)

コハク酸脱水素酵素阻害剤 (SDHI 剤) として、[b-3. 1] ベノダニル (benodanil)、[b-3. 2] ベンゾビンジフルピル (benzovindiflupyr)、[b-3. 3] ビキサフェン (bixafen)、[b-3. 4] ボスカリド (boscalid)、[b-3. 5] カルボキシシン (carboxin)、[b-3. 6] フェンフラム (fenfuram)、[b-3. 7] フルオピラム (fluopyram)、[b-3. 8] フルトラニル (flutolanil)、[b-3. 9] フルキサピロキサド (fluxapyroxad)、[b-3. 10] フラメトピル (furametpyr)、[b-3. 11] イソフェタミド (isofetamid)、[b-3. 12] イソピラザム (isopyrazam)、[b-3. 13] メプロニル (mepronil)、[b-3. 14] オキシカルボキシシン (oxycarboxin)、[b-3. 15] ペンチオピラド (penthiopyrad)、[b-3. 16] ペンフルフェン

(penflufen)、[b-3. 17] ピジフルメトフェン (pydiflumetofen)、[b-3. 18] セダキサン (sedaxane)、[b-3. 19] チフルザミド (thifluzamide)、[b-3. 20] ピラジフルミド (pyraziflumid) 等が挙げられる。

[0961] b-4 : キノン外部阻害剤 (QoI 剤)

キノン外部阻害剤 (QoI 剤) として、[b-4. 1] アゾキシストロビン (azoxystrobin)、[b-4. 2] クモキシストロビン (coumoxystrobin)、[b-4. 3] ジモキシストロビン (dimoxystrobin)、[b-4. 4] エノキサストロビン (enoxastrobin)、[b-4. 5] ファモキサドン (famoxadone)、[b-4. 6] フェンアミドン (fenamidone)、[b-4. 7] フェナミンストロビン (fenaminstrobin)、[b-4. 8] フルフェノキシストロビン (flufenoxystrobin)、[b-4. 9] フルオキサストロビン (fluoxastrobin)、[b-4. 10] クレソキシムメチル (kresoxim-methyl)、[b-4. 11] マンデストロビン (mandestrobin)、[b-4. 12] メトミノストロビン (metominostrobin)、[b-4. 13] オリサストロビン (orysastrobin)、[b-4. 14] ピコキシストロビン (picoxystrobin)、[b-4. 15] ピラクロストロビン (pyraclostrobin)、[b-4. 16] ピラメトストロビン (pyrametostrobin)、[b-4. 17] ピラオキシストロビン (pyraoxystrobin)、[b-4. 18] ピリベンカルブ (pyribencarb)、[b-4. 19] トリクロピリカルブ (tricyclopyricarb)、[b-4. 20] トリフロキシストロビン (trifloxystrobin) 等が挙げられる。

[0962] b-5 : キノン内部阻害剤 (QiI 剤)

キノン内部阻害剤 (QiI 剤) として、[b-5. 1] シアゾファミド (

cyazofamid)、[b-5. 2] アミスルブロム (amisulbrom) 等が挙げられる。

[0963] b-6 : 酸化的リン酸化脱共役阻害剤

酸化的リン酸化脱共役阻害剤として、[b-6. 1] ビナパクリル (binapacryl)、[b-6. 2] メプチルジノカップ (meptyldinocap)、[b-6. 3] ジノカップ (dinocap)、[b-6. 4] フルアジナム (fluazinam) 等が挙げられる。

[0964] b-7 : キノン外部スチグマテリン結合サブサイト阻害剤 (QoS I 剤)

キノン外部スチグマテリン結合サブサイト阻害剤 (QoS I 剤) として、[b-7. 1] アメトクトラジン (ametoctradin) 等が挙げられる。

[0965] b-8 : アミノ酸生合成阻害剤

アミノ酸生合成阻害剤として、[b-8. 1] シプロジニル (cyprodinil)、[b-8. 2] メパニピリム (mepanipyrim)、[b-8. 3] ピリメタニル (pyrimethanil) 等が挙げられる。

[0966] b-9 : タンパク質生合成阻害剤

タンパク質生合成阻害剤として、[b-9. 1] ストレプトマイシン (streptomycin)、[b-9. 2] ブラストサイジンS (blasticidin-S)、[b-9. 3] カスガマイシン (kasugamycin)、[b-9. 4] オキシテトラサイクリン (oxytetracycline) 等が挙げられる。

[0967] b-10 : シグナル伝達阻害剤

シグナル伝達阻害剤として、[b-10. 1] フェンピクロニル (fenpiclonil)、[b-10. 2] フルジオキシソニル (fludioxonil)、[b-10. 3] キノキシフェン (quinoxifen)、[b-10. 4] プロキナジド (proquinazid)、[b-10. 5] クロゾリネート (chlozolinate)、[b-10. 6] ジメ

タクロン (dimethachlone)、[b-10.7] イプロジオン (iprodione)、[b-10.8] プロシミドン (procymidone)、[b-10.9] ビンクロゾリン (vinclozolin) 等が挙げられる。

[0968] b-11：脂質および細胞膜生合成阻害剤

脂質および細胞膜生合成阻害剤として、[b-11.1] エジフェンホス (edifenphos)、[b-11.2] イプロベンホス (iprobefos)、[b-11.3] ピラゾホス (pyrazophos)、[b-11.4] イソプロチオラン (isoprothiolane)、[b-11.5] ビフェニル (biphenyl)、[b-11.6] クロロネブ (chloroneb)、[b-11.7] ジクロラン (dicloran)、[b-11.8] キントゼン (quintozene)、[b-11.9] テクナゼン (tecnazene)、[b-11.10] トルクロホスメチル (tolclofos-methyl)、[b-11.11] エトリジアゾール (echlomezol or etridiazole)、[b-11.12] ヨードカルブ (iodocarb)、[b-11.13] プロパモカルブ (propamocarb)、[b-11.14] プロチオカルブ (prothiocarb) 等が挙げられる。

[0969] b-12：脱メチル化阻害剤 (DMI 剤)

脱メチル化阻害剤 (DMI 剤) として、[b-12.1] アザコナゾール (azaconazole)、[b-12.2] ビテルタノール (bitertanol)、[b-12.3] ブロムコナゾール (bromuconazole)、[b-12.4] シプロコナゾール (cyproconazole)、[b-12.5] ジフェノコナゾール (difenoconazole)、[b-12.6] ジニコナゾール (diniconazole)、[b-12.7] ジニコナゾールM (diniconazole-M)、[b-12.8] エポキシコナゾール (epoxiconazole)、[b-12.9] エタコナゾール (etaconazole)、[b-12.1

0] フェナリモル (fenarimol)、[b-12. 11] フェンブコナゾール (fenbuconazole)、[b-12. 12] フルキンコナゾール (fluquinconazole)、[b-12. 13] キンコナゾール (quinconazole)、[b-12. 14] フルシラゾール (flusilazole)、[b-12. 15] フルトリアホル (flutriafol)、[b-12. 16] ヘキサコナゾール (hexaconazole)、[b-12. 17] イマザリル (imazalil)、[b-12. 18] イミベンコナゾール (imibenconazole)、[b-12. 19] イプコナゾール (ipconazole)、[b-12. 20] メトコナゾール (metconazole)、[b-12. 21] ミクロブタニル (myclobutanil)、[b-12. 22] ヌアリモル (nuarimol)、[b-12. 23] オキシポコナゾール (oxpoconazole)、[b-12. 24] オキシポコナゾールフマル酸塩 (oxpoconazole fumarate)、[b-12. 25] ペフラゾエート (pefurazoate)、[b-12. 26] ペンコナゾール (penconazole)、[b-12. 27] プロクロラズ (prochloraz)、[b-12. 28] プロピコナゾール (propiconazole)、[b-12. 29] プロチオコナゾール (prothioconazole)、[b-12. 30] ピリフェノックス (pyrifenoxx)、[b-12. 31] ピリソキサゾール (pyrisoxazole)、[b-12. 32] シメコナゾール (simeconazole)、[b-12. 33] テブコナゾール (tebuconazole)、[b-12. 34] テトラコナゾール (tetraconazole)、[b-12. 35] トリアジメホン (triadimefon)、[b-12. 36] トリアジメノール (triadimenol)、[b-12. 37] トリフルミゾール (triflumizole)、[b-12. 38] トリホリン (triforine)、[b-12. 39] トリチコナゾール (triticonazole) [b-12. 40] メフェントリフルコナ

ゾール (mefentrifluconazole)、[b-12.41] イプフェントリフルコナゾール (ipfentrifluconazole) 等が挙げられる。

[0970] b-13 : アミン系殺菌剤

アミン系殺菌剤として、[b-13.1] アルジモルフ (aldimorph)、[b-13.2] ドデモルフ (dodemorph)、[b-13.3] フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、[b-13.4] トリデモルフ (tridemorph)、[b-13.5] フェンプロピジン (fenpropidin)、[b-13.6] ピペラリン (piperalin)、[b-13.7] スピロキサミン (spiroxamine) 等が挙げられる。

[0971] b-14 : ステロール生合成のC4位脱メチル化における3-ケト還元酵素阻害剤

ステロール生合成のC4位脱メチル化における3-ケト還元酵素阻害剤として、[b-14.1] フェンヘキサミド (fenhexamid)、[b-14.2] フェンピラザミン (fenpyrazamine) 等が挙げられる。

[0972] b-15 : ステロール生合成のスクアレンエポキシダーゼ阻害剤

ステロール生合成のスクアレンエポキシダーゼ阻害剤として、[b-15.1] ピリブチカルブ (pyributicarb)、[b-15.2] ナフチフィン (naftifine)、[b-15.3] テルビナフィン (terbinafine) 等が挙げられる。

[0973] b-16 : 細胞壁生合成阻害剤

細胞壁生合成阻害剤として、[b-16.1] ポリオキシン類 (polyoxins)、[b-16.2] ジメトモルフ (dimethomorph)、[b-16.3] フルモルフ (flumorph)、[b-16.4] ピリモルフ (pyrimorph)、[b-16.5] ベンチアバリカルブ (benthiavalicarb)、[b-16.6] ベンチアバリカル

ブイソプロピル (benthivalicarb-isopropyl)、
[b-16.7] イプロバリカルブ (iprovalicarb)、[b-16.8] マンジプロパミド (mandipropamid)、[b-17.9] バリフェナレート (valifenalate) 等が挙げられる。

[0974] b-17: メラニン生合成阻害剤

メラニン生合成阻害剤として、[b-17.1] フサライド (phthalide or fthalide)、[b-17.2] ピロキロン (pyroquilon)、[b-17.3] トリシクラゾール (tricyclazole)、[b-17.4] カルプロパミド (carpropamid)、[b-17.5] ジクロシメット (diclocymet)、[b-17.6] フェノキサニル (fenoxanil)、[b-17.7] トルプロカルブ (tolprocarb) 等が挙げられる。

[0975] b-18: 宿主植物抵抗性誘導剤

宿主植物抵抗性誘導剤として、[b-18.1] アシベンゾラルSメチル (acibenzolar-S-methyl)、[b-18.2] プロベナゾール (probenazole)、[b-18.3] チアジニル (tiadinil)、[b-18.4] イソチアニル (isotianil)、[b-18.5] ラミナリン (laminarin) 等が挙げられる。

[0976] b-19: ジチオカーバメート系殺菌剤

ジチオカーバメート系殺菌剤として、[b-19.1] マンコゼブまたはマンゼブ (mancozeb or manzeb)、[b-19.2] マンネブ (maneb)、[b-19.3] メチラム (metiram)、[b-19.4] プロピネブ (propineb)、[b-19.5] チウラム (thiram)、[b-19.6] ジネブ (zineb)、[b-19.7] ジラム (ziram)、[b-19.8] フェルバム (ferbam) 等が挙げられる。

[0977] b-20: フタルイミド系殺菌剤

フタルイミド系殺菌剤として、[b-20.1] キャプタン (captan)

n)、[b-20.2] キャプタホール (captafol)、[b-20.3] ホルペット (folpet)、[b-20.4] フルオロホルペット (fluorofolpet) 等が挙げられる。

[0978] b-21 : グアニジン系殺菌剤

グアニジン系殺菌剤として、[b-21.1] グアザチン (guazatine)、[b-21.2] イミノクタジン (iminooctadine)、[b-21.3] イミノクタジンアルベシル酸塩 (iminooctadine albesilate)、[b-21.4] イミノクタジン三酢酸塩 (iminooctadine triacetate) 等が挙げられる。

[0979] b-22 : 多作用点接触活性型殺菌剤

多作用点接触活性型殺菌剤として、[b-22.1] 塩基性塩化銅 (copper oxychloride)、[b-22.2] 水酸化第二銅 (copper (II) hydroxide)、[b-22.3] 塩基性硫酸銅 (copper hydroxide sulfate)、[b-22.4] 有機銅化合物 (organocopper compound)、[b-22.5] ドデシルベンゼンスルホン酸ビスエチレンジアミン銅錯塩 [I] (Dodecylbenzenesulphonic acid bisethylenediamine copper [I] salt、DBEDC)、[b-22.6] 硫黄 (sulphur)、[b-22.7] フルオルイミド (fluoroimide)、[b-22.8] クロロタロニル (chlorothalonil)、[b-22.9] ジクロフルアニド (dichlofluanid)、[b-22.10] トリルフルアニド (tolylfluanid)、[b-22.11] アニラジン (anilazine)、[b-22.12] ジチアノン (dithianon)、[b-22.13] キノメチオナート (chinomethionate or quinomethionate)、[b-22.14] ハウチワマメ苗木の子葉からの抽出物 (BLAD) 等が挙げられる。

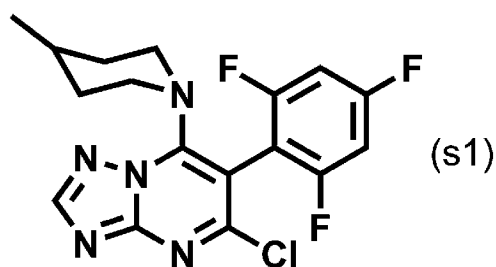
[0980] b-23 : その他の殺菌剤

その他の殺菌剤として、[b-23. 1] ジクロベンチアゾクス (dic h l o b e n t i a z o x)、[b-23. 2] フェンピコキサミド (f e n p i c o x a m i d)、[b-23. 3] ジピメチトロン (d i p y m e t i t r o n e)、[b-23. 4] ブピリメート (b u p i r i m a t e)、[b-23. 5] ジメチリモール (d i m e t h i r i m o l)、[b-23. 6] エチリモール (e t h i r i m o l)、[b-23. 7] 酢酸トリフェニルスズ (f e n t i n a c e t a t e)、[b-23. 8] 塩化トリフェニルスズ (f e n t i n c h l o r i d e)、[b-23. 9] 水酸化トリフェニルスズ (f e n t i n h y d r o x i d e)、[b-23. 10] オキシリニック酸 (o x o l i n i c a c i d)、[b-23. 11] ヒメキサゾール (h y m e x a z o l)、[b-23. 12] オクチリノン (o c t h i l i n o n e)、[b-23. 13] ホセチル (f o s e t y l)、[b-23. 14] 亜リン酸 (p h o s p h o r o u s a c i d)、[b-23. 15] 亜リン酸のナトリウム塩 (s o d i u m p h o s p h i t e)、[b-23. 16] 亜リン酸のアンモニウム塩 (a m m o n i u m p h o s p h i t e)、[b-23. 17] 亜リン酸のカリウム塩 (p o t a s s i u m p h o s p h i t e)、[b-23. 18] テクロフタラム (t e c l o f t a l a m)、[b-23. 19] トリアゾキシド (t r i a z o x i d e)、[b-23. 20] フルスルファミド (f l u s u l f a m i d e)、[b-23. 21] ジクロメジン (d i c l o m e z i n e)、[b-23. 22] シルチオフアム (s i l t h i o f a m)、[b-23. 23] ジフルメトリム (d i f l u m e t o r i m)、[b-23. 24] メタスルホカルブ (m e t h a s u l f o c a r b)、[b-23. 25] シフルフェナミド (c y f l u f e n a m i d)、[b-23. 26] メトラフェノン (m e t r a f e n o n e)、[b-23. 27] ピリオフェノン (p y r i o f e n o n e)、[b-23. 28] ドジン (d o d i n e)、[b-23. 29] フルチアニル (f l u t i a n i l)、[b-23. 30] フェリムゾン (f e r i m z o n e)、[

b-23.31] オキサチアピプロリン (oxathiapiprolin)、
 [b-23.32] テブフロキン (tebufloquin)、[b-23.33] ピカルブトラゾクス (picarbutrazox)、[b-23.34] バリダマイシン類 (validamycins)、[b-23.35] シモキサニル (cymoxanil)、[b-23.36] キノフメリン (quinofumelin)、

[0981] [b-23.37] 式 (s1)

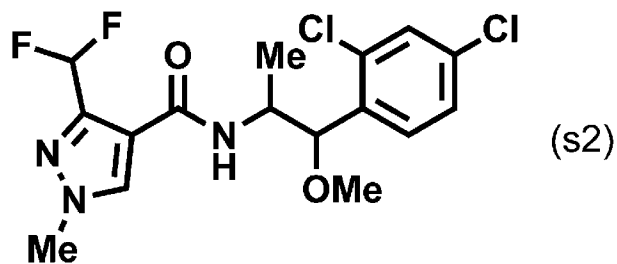
[化120]



で表される化合物 (国際公開第98/046607号参照)、

[0982] [b-23.38] 式 (s2)

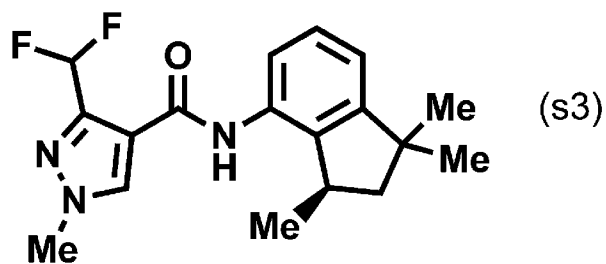
[化121]



で表される化合物 (国際公開第08/148570号参照)、

[0983] [b-23.39] 式 (s3)

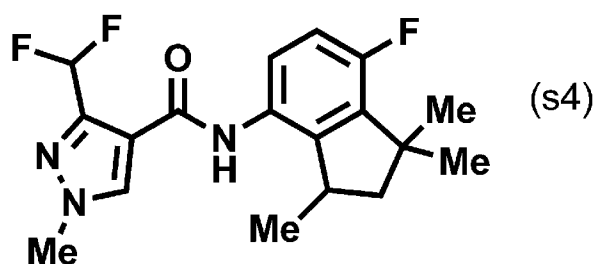
[化122]



で表される化合物（国際公開第 9 2 / 0 1 2 9 7 0 号参照）、

[0984] [b-23.40] 式 (s4)

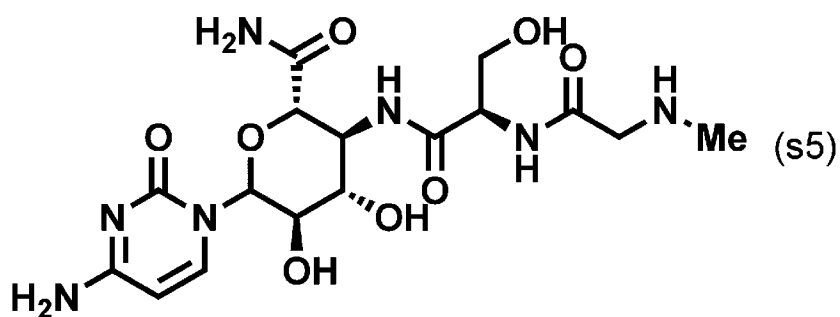
[化123]



で表される化合物（国際公開第 1 2 / 0 8 4 8 1 2 号参照）、

[0985] [b-23.41] 式 (s5)

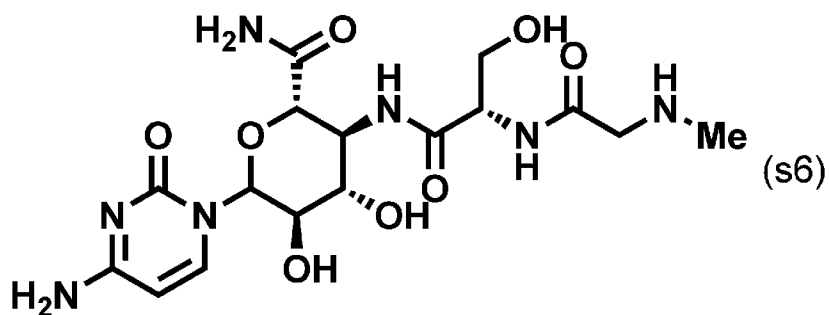
[化124]



で表される化合物 (gougerotin)、

[0986] [b-23.42] 式 (s6)

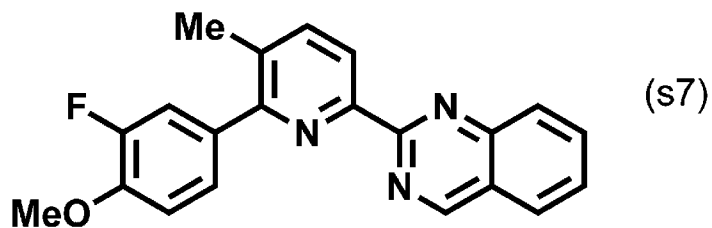
[化125]



で表される化合物 (ningnanmycin)、

[0987] [b-23.43] 式 (s7)

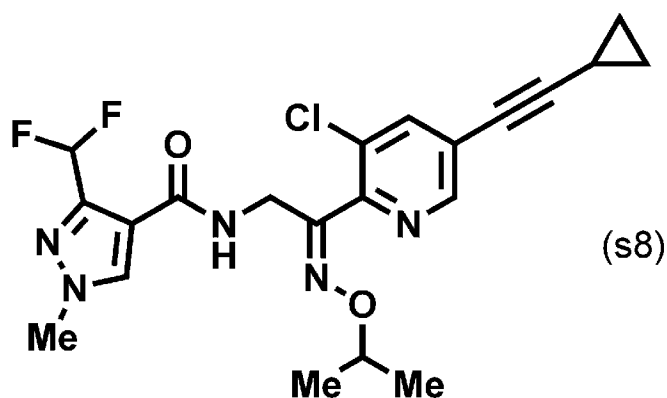
[化126]



で表される化合物（国際公開第10/136475号参照）、

[0988] [b-23.44] 式(s8)

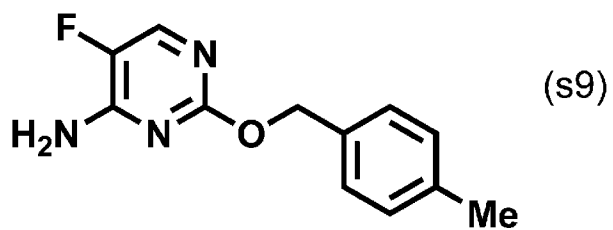
[化127]



で表される化合物（国際公開第14/010737号参照）、

[0989] [b-23.45] 式(s9)

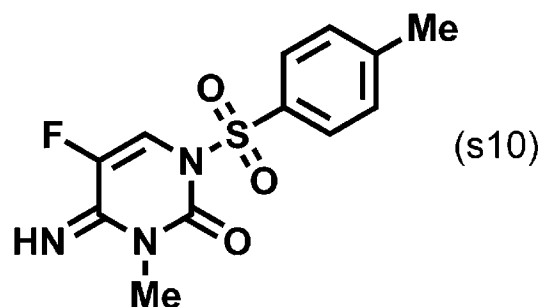
[化128]



で表される化合物（国際公開第11/085084号参照）、

[0990] [b-23.46] 式(s10)

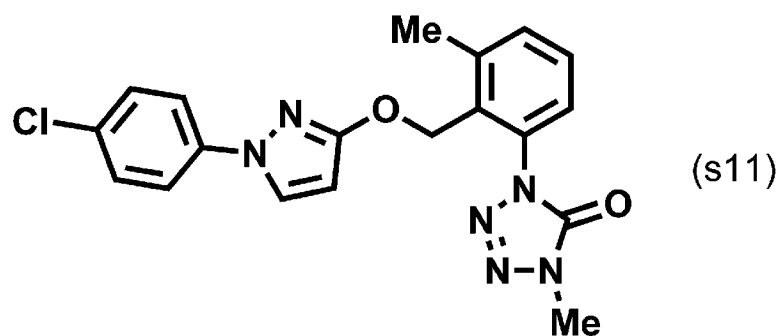
[化129]



で表される化合物（国際公開第11／137002号参照）、

[0991] [b-23.47] 式 (s11)

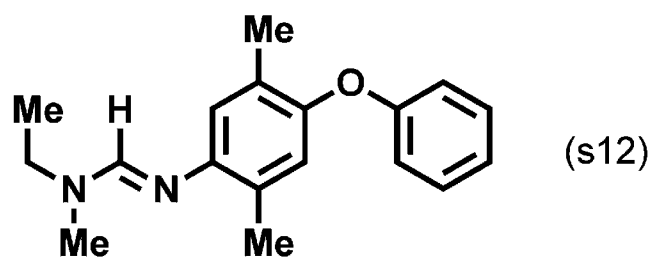
[化130]



で表される化合物（国際公開第13／162072号参照）、

[0992] [b-23.48] 式 (s12)

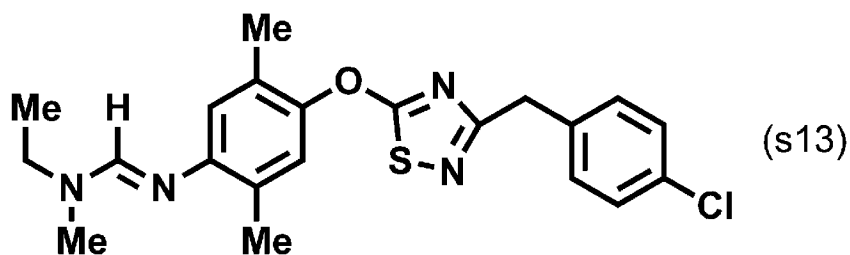
[化131]



で表される化合物（国際公開第08／110313号参照）、

[0993] [b-23.49] 式 (s13)

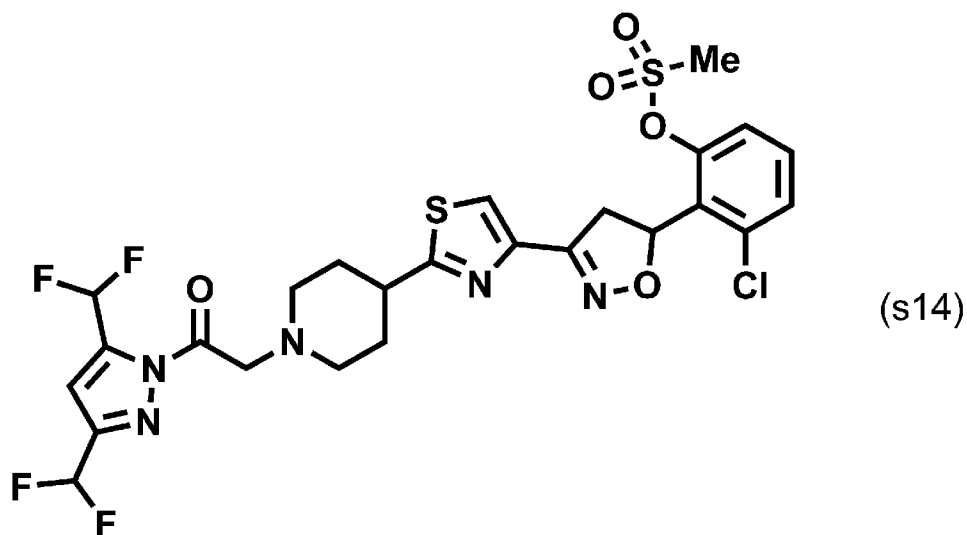
[化132]



で表される化合物（国際公開第09／156098号参照）、

[0994] [b-23.50] 式 (s14)

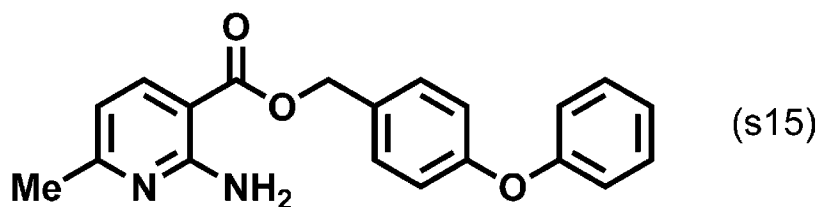
[化133]



で表される化合物（国際公開第12／025557号参照）、

[0995] [b-23.51] 式 (s15)

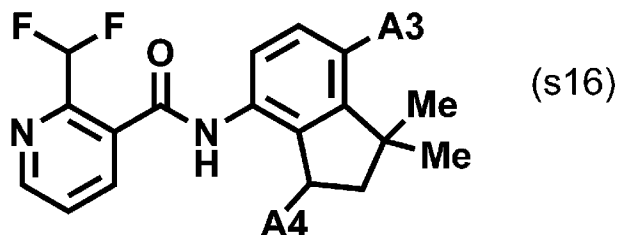
[化134]



で表される化合物（国際公開第14／006945号参照）、

[0996] [b-23.52] 式 (s16)

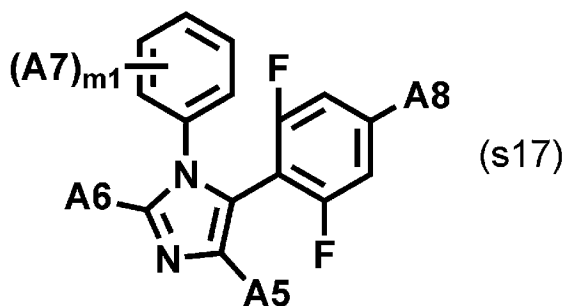
[化135]



[式中、A 3は、水素原子、ハロゲン原子、C 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、またはシアノ基を表し、A 4は、水素原子、C 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、またはC 3～C 8のシクロアルキル基を表す。] で表される化合物（国際公開第 1 4 / 0 9 5 6 7 5 号参照）、

[0997] [b-23. 53] 式 (s 1 7)

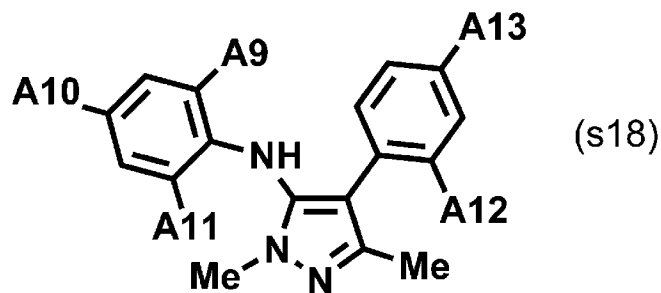
[化136]



[式中、m 1は、0～3の整数を表し、A 5およびA 6は、それぞれ独立していて、ハロゲン原子、またはC 1～C 6のアルキル基を表し、A 7およびA 8は、それぞれ独立していて、ハロゲン原子、またはC 1～C 6のアルコキシ基を表し、m 1が2以上の場合、2以上のA 7は、それぞれ独立した置換基を表し、同一または異なっていてよい。] で表される化合物（国際公開第 0 9 / 1 3 7 5 3 8 号、国際特許第 0 9 / 1 3 7 6 5 1 号参照）、

[0998] [b-23. 54] 式 (s 1 8)

[化137]

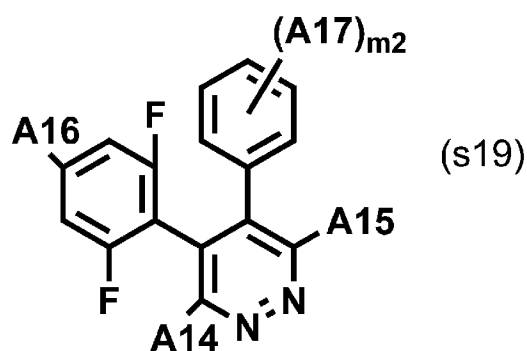


[式中、A 9 および A 1 0 は、それぞれ独立していて、水素原子、またはハロゲン原子を表し、A 1 1 は、ハロゲン原子を表し、A 1 2 は、ハロゲン原子、または C 1 ～ C 6 のアルキル基を表し、A 1 3 は、ハロゲン原子、シアノ基、C 1 ～ C 6 のアルキル基、または C 1 ～ C 6 のアルコキシ基を表す。

] で表される化合物（国際公開第 1 2 / 0 3 1 0 6 1 号参照）、

[0999] [b-23. 55] 式 (s19)

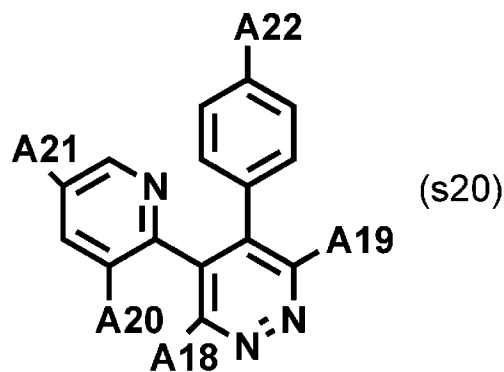
[化138]



[式中、m 2 は、0 ～ 6 の整数を表し、A 1 4 および A 1 5 は、それぞれ独立していて、ハロゲン原子、シアノ基、または C 1 ～ C 6 のアルキル基を表し、A 1 6 は、水素原子、ハロゲン原子、または C 1 ～ C 6 のアルコキシ基を表し、A 1 7 は、ハロゲン原子、または C 1 ～ C 6 のアルコキシ基を表し、m 2 が 2 以上の場合、2 以上の A 1 7 は、それぞれ独立した置換基を表し、同一または異なっていてよい。] で表される化合物（国際公開第 0 5 / 1 2 1 1 0 4 号参照）、

[1000] [b-23. 56] 式 (s20)

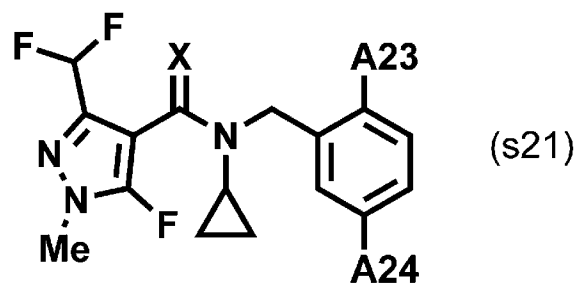
[化139]



[式中、A 1 8 および A 1 9 は、それぞれ独立していて、ハロゲン原子、シアノ基、または C 1 ～ C 6 のアルキル基を表し、A 2 0、A 2 1 および A 2 2 は、それぞれ独立していて、水素原子、ハロゲン原子、または C 1 ～ C 6 のアルコキシ基を表す。] で表される化合物（国際公開第 0 7 / 0 6 6 6 0 1 号参照）、

[1001] [b-23. 57] 式 (s 2 1)

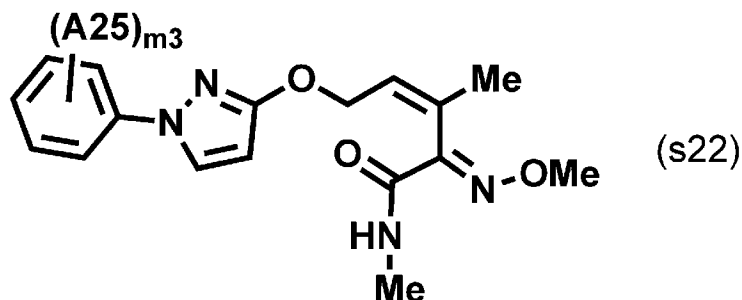
[化140]



[式中、A 2 3 および A 2 4 は、それぞれ独立していて、水素原子、ハロゲン原子、C 1 ～ C 6 のアルキル基、または C 3 ～ C 8 のシクロアルキル基を表し、X は、酸素原子または硫黄原子を表す。] で表される化合物（国際公開第 0 7 / 0 8 7 9 0 6 号、国際特許第 0 9 / 0 1 6 2 2 0 号、国際特許第 1 0 / 1 3 0 7 6 7 号参照）、

[1002] [b-23. 58] 式 (s 2 2)

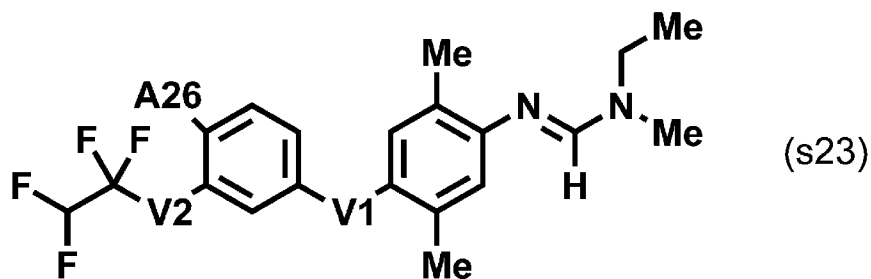
[化141]



[式中、 m_3 は、0～5の整数を表し、A25は、ハロゲン原子、C1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、C1～C6のアルコキシ基、C1～C6のハロアルコキシ基、またはC3～C8のシクロアルキル基を表し、 m_3 が2以上の場合、2以上のA25は、それぞれ独立した置換基を表し、同一または異なっていてよい。]で表される化合物（国際公開第13／092224号参照）、

[1003] [b-23. 59] 式 (s23)

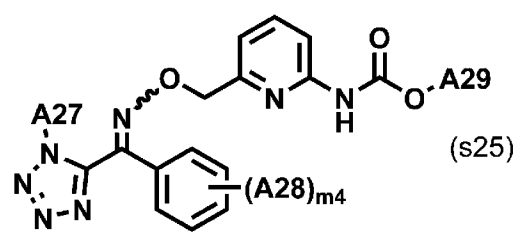
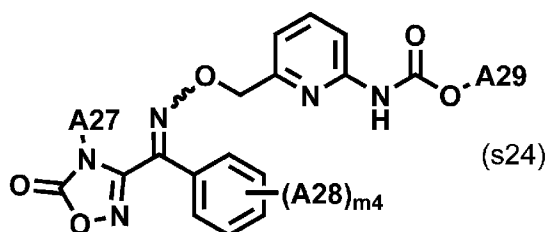
[化142]



[式中、A26は、水素原子、またはハロゲン原子を表し、V1およびV2は、それぞれ独立していて、酸素原子、または硫黄原子を表す。]で表される化合物（国際公開第12／025450号参照）、

[1004] [b-23. 60] 式 (s24) または式 (s25)

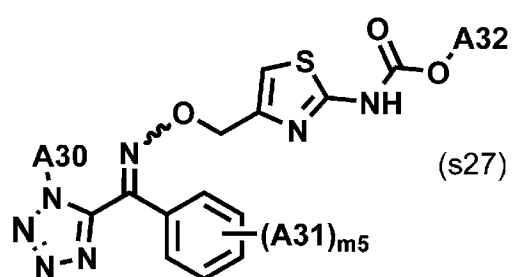
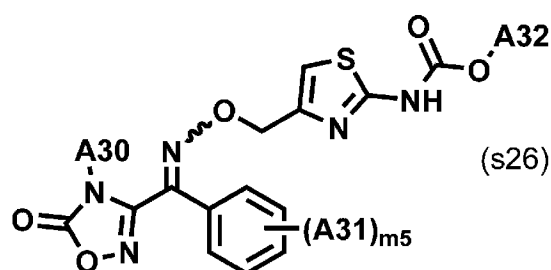
[化143]



[式中、 m_4 は、0～5の整数を表し、 A_{27} は、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基を表し、 A_{28} は、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、または $C_1 \sim C_6$ のハロアルキル基を表し、 m_4 が2以上の場合、2以上の A_{28} は、それぞれ独立した置換基を表し、同一または異なっていてよく、 A_{29} は、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基、または $C_3 \sim C_6$ のアルキニル基を表す。] で表される化合物（国際公開第13／037717号参照）、

[1005] [b-23. 61] 式 (s26) または式 (s27)

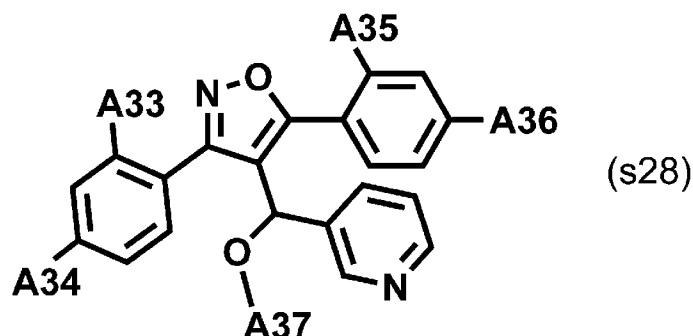
[化144]



[式中、 m_5 は、0～5の整数を表し、 A_{30} は、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基を表し、 A_{31} は、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、または $C_1 \sim C_6$ のハロアルキル基を表し、 m_5 が2以上の場合、2以上の A_{31} は、それぞれ独立した置換基を表し、同一または異なっていてよく、 A_{32} は、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基、または $C_3 \sim C_6$ のアルキニル基を表す。] で表される化合物（国際公開第13／037717号参照）、

[1006] [b-23. 62] 式 (s28)

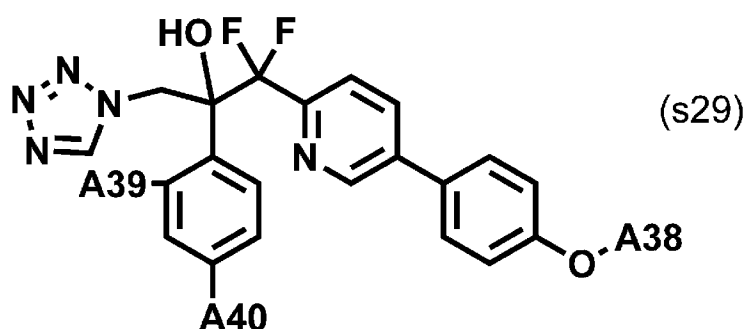
[化145]



[式中、A 3 3、A 3 4、A 3 5およびA 3 6は、それぞれ独立していて、水素原子、またはハロゲン原子を表し、A 3 7は、水素原子、アセチル基、またはベンゾイル基を表す。] で表される化合物（国際公開第06／031631号、国際特許第10／069882号参照）、

[1007] [b-23. 63] 式 (s 2 9)

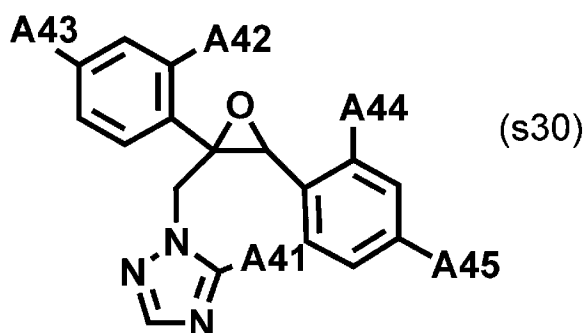
[化146]



[式中、A 3 8は、C 1～C 6のアルキル基、またはC 1～C 6のハロアルキル基を表し、A 3 9およびA 4 0は、それぞれ独立していて、水素原子、またはハロゲン原子を表す。] で表される化合物（国際公開第14／043376号参照）、

[1008] [b-23. 64] 式 (s 3 0)

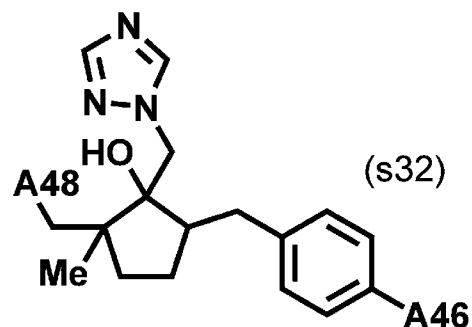
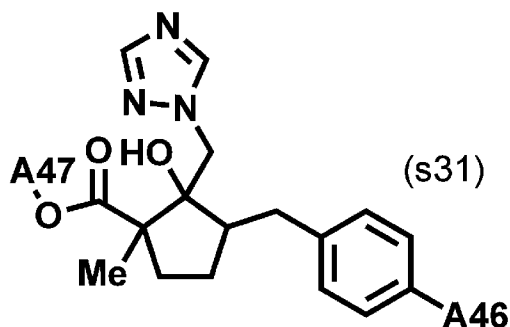
[化147]



[式中、A 4 1は、水素原子、水硫基（-SH）、チオシアン酸基（-SCN）、またはC 1～C 6のアルキルチオ基を表し、A 4 2、A 4 3、A 4 4およびA 4 5は、それぞれ独立していて、水素原子、またはハロゲン原子を表す。] で表される化合物（国際公開第09／077443号参照）、

[1009] [b-23. 65] 式 (s 3 1) または式 (s 3 2)

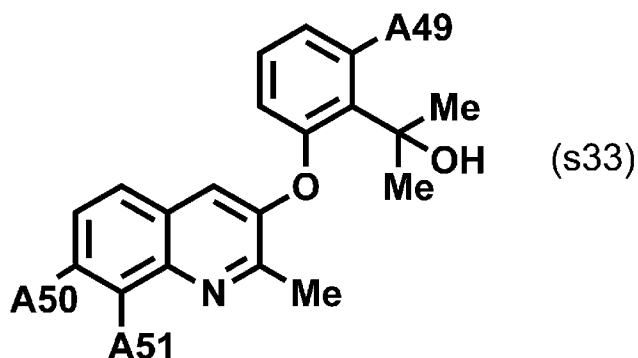
[化148]



[式中、A 4 6 は、水素原子、またはハロゲン原子を表し、A 4 7 は、C 1 ～C 6 のアルキル基を表し、A 4 8 は、ハロゲン原子を表す。] で表される化合物（国際公開第 1 1 / 0 7 0 7 7 1 号参照）、

[1010] [b-23.66] 式 (s33)

[化149]



[式中、A 4 9、A 5 0 および A 5 1 は、それぞれ独立して、水素原子、またはハロゲン原子を表す。] で表される化合物（国際公開第 1 1 / 0 8 1 1 7 4 号参照）等が挙げられる。

[1011] 本発明化合物と混合して使用することができる殺虫剤に含まれる具体的な成分は、以下の群 c で例示され、これらの塩、異性体および N-オキシド体を含む。ただし、公知の殺虫剤はこれらに限定されるものではない。

[1012] 群 c :

c-1 : カーバメート系アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害剤

カーバメート系アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害剤として、

[c-1.1] ホスホカルブ (phosphocarb)、[c-1.2]

アラニカルブ (alanycarb)、[c-1. 3] ブトカルボキシム (butocarboxim)、[c-1. 4] ブトキシカルボキシム (butoxycarboxim)、[c-1. 5] チオジカルブ (thiodicarb)、[c-1. 6] チオファノックス (thiofanox)、[c-1. 7] アルジカルブ (aldicarb)、[c-1. 8] ベンジオカルブ (bendiocarb)、[c-1. 9] ベンフラカルブ (benfuracarb)、[c-1. 10] カルバリル (carbaryl)、[c-1. 11] カルボフラン (carbofuran)、[c-1. 12] カルボスルファン (carbosulfan)、[c-1. 13] エチオフエンカルブ (ethiofencarb)、[c-1. 14] フェノブカルブ (fenobucarb)、[c-1. 15] ホルメタネート (formetanate)、[c-1. 16] フラチオカルブ (furathiocarb)、[c-1. 17] イソプロカルブ (isoprocarb)、[c-1. 18] メチオカルブ (methiocarb)、[c-1. 19] メソミル (methomyl)、[c-1. 20] オキサミル (oxamyl)、[c-1. 21] ピリミカルブ (pirimicarb)、[c-1. 22] プロポキスル (propoxur)、[c-1. 23] トリメタカルブ (trimethacarb)、[c-1. 24] XMC (3, 5-xylyl methylcarbamate)、[c-1. 25] アリキシカルブ (allyxycarb)、[c-1. 26] アルドキシカルブ (aldoxycarb)、[c-1. 27] ブフェンカルブ (bufencarb)、[c-1. 28] ブタカルブ (butacarb)、[c-1. 29] カーバノレート (carbanolate)、[c-1. 30] メトルカルブ (metolcarb)、[c-1. 31] キシルイルカルブ (xylylcarb)、[c-1. 32] フェノチオカルブ (fenothiocarb)、[c-1. 33] キシルルカルブ (xylylcarb)、[c-1. 34] ベンダイオカルブ (bendiocarb) 等が挙げられる。

[1013] c-2 : 有機リン系アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害剤

有機リン系アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害剤として、[c-2. 1] アセフェート (acephate)、[c-2. 2] アザメチホス (azamethiphos)、[c-2. 3] アジンホス-メチル (azinphos-methyl)、[c-2. 4] アジンホス-エチル (azinphos-ethyl)、[c-2. 5] エセフォン (ethephon)、[c-2. 6] カズサホス (cadusafos)、[c-2. 7] クロルエトキシホス (chlorethoxyfos)、[c-2. 8] クロルフェンビンホス (chlorfenvinphos)、[c-2. 9] クロルメホス (chlormephos)、[c-2. 10] クロルピリホス (chlorpyrifos)、[c-2. 11] クロルピリホス-メチル (chlorpyrifos-methyl)、[c-2. 12] クマホス (coumaphos)、[c-2. 13] シアノホス (cyanophos)、[c-2. 14] デメトン-S-メチル (demeton-S-methyl)、[c-2. 15] ダイアジノン (diazinon)、[c-2. 16] ジクロフェンチオン (dichlofenthion)、[c-2. 17] ジクロルボス (dichlorvos)、[c-2. 18] ジクロトホス (dicrotophos)、[c-2. 19] ジメトエート (dimethoate)、[c-2. 20] ジメチルビンホス (dimethylvinphos)、[c-2. 21] ジスルホトン (disulfoton)、[c-2. 22] O-エチル O-4-ニトロフェニル フェニルホスホノチオアート (O-ethyl O-4-nitrophenyl phenylphosphonothioate)、[c-2. 23] エチオン (ethion)、[c-2. 24] エトプロホス (ethoprophos)、[c-2. 25] ファムフル (famphur)、[c-2. 26] フェナミホス (fenamiphos)、[c-2. 27] フェニトロチオン (fenitrothion)、[c-2. 28] フェンチオン (fenthion)、[c-2. 29] ホスチアゼート (fosthi

azate)、[c-2. 30] ヘプテノホス (heptenophos)、
[c-2. 31] イソフェンホスーメチル (isofenphos-methyl)、
[c-2. 32] イソカルボホス (isocarbophos)、
[c-2. 33] イソキサチオン (isoxathion)、[c-2. 34] マラチオン (malathion)、
[c-2. 35] メカルバム (mecarbam)、[c-2. 36] メタミドホス (methamidophos)、
[c-2. 37] メチダチオン (methidathion)、
[c-2. 38] メビンホス (mevinphos)、[c-2. 39] モノクロトホス (monocrotophos)、
[c-2. 40] ナレド (naled)、[c-2. 41] オメトエート (omethoate)、
[c-2. 42] オキシデメトンーメチル (oxydemeton-methyl)、
[c-2. 43] パラチオン (parathions)、[c-2. 44] パラチオンーメチル (parathion-methyl)、
[c-2. 45] フェントエート (phenthoate)、[c-2. 46] ホレート (phorate)、
[c-2. 47] ホサロン (phosalone)、[c-2. 48] ホスメット (phosmet)、
[c-2. 49] ホスファミドン (phosphamidon)、[c-2. 50] ホキシム (phoxim)、
[c-2. 51] ピリミホスーメチル (pirimiphos-methyl)、[c-2. 52] プロフェノホス (profenofos)、
[c-2. 53] プロペタンホス (propetamphos)、[c-2. 54] プロチオホス (prothiofos)、
[c-2. 55] ピラクロホス (pyraclofos)、[c-2. 56] ピリダフェンチオン (pyridaphenthion)、
[c-2. 57] キナルホス (quinalphos)、[c-2. 58] スルホテップ (sulfotep)、
[c-2. 59] テブピリムホス (tebupirimfos)、[c-2. 60] テメホス (temephos)、
[c-2. 61] テルブホス (terbufos)、[c-2. 62] チオメトン (thiometon)、
[c-2. 63] トリアゾホス (triazophos)

s)、[c-2. 64] トリクロルホン (trichlorfon)、[c-2. 65] バミドチオン (vamidothion)、[c-2. 66] クロルチオン (chlorothion)、[c-2. 67] ブロムフェンビンホス (bromfenvinfos)、[c-2. 68] ブロモホス (bromophos)、[c-2. 69] ブロモホスーエチル (bromophos-ethyl)、[c-2. 70] ブタチオホス (butathiofos)、[c-2. 71] カルボフェノチオン (carbophenothion)、[c-2. 72] クロルホキシム (chlorphoxim)、[c-2. 73] スルプロホス (sulprofos)、[c-2. 74] ジアミダホス (diamidafos)、[c-2. 75] テトラクロルビンホス (tetrachlorvinphos)、[c-2. 76] プロパホス (propaphos)、[c-2. 77] メスルフェンホス (mesulfenfos)、[c-2. 78] ジオキサベンゾホス (dioxabenzofos)、[c-2. 79] エトリムホス (etrimfos)、[c-2. 80] オキシデプロホス (oxydeprofos)、[c-2. 81] ホルモチオン (formothion)、[c-2. 82] フェンスルホチオン (fensulfothion)、[c-2. 83] イサゾホス (isazofos)、[c-2. 84] イミシアホス (imicyafos)、[c-2. 85] イサミドホス (isamidofos)、[c-2. 86] チオナジン (thionazin)、[c-2. 87] ホスチエタン (fosthietan) 等が挙げられる。

[1014] c-3 : GABA 作動性塩素イオンチャネルブロッカー

GABA 作動性塩素イオンチャネルブロッカーとして、[c-3. 1] クロルデン (chlordane)、[c-3. 2] エンドスルフアン (endosulfan)、[c-3. 3] リンデン (lindane)、[c-3. 4] ジエノクロル (dienochlor)、[c-3. 5] エチプロール (ethiprole)、[c-3. 6] フィプロニル (fipronil)、[c-3. 7] アセトプロール (acetoprole) 等が挙げ

られる。

[1015] c-4 : ナトリウムチャネルモジュレーター

ナトリウムチャネルモジュレーターとして、[c-4. 1] アクリナトリン (acrinathrin)、[c-4. 2] アレスリン [(1R) -アイソマー] (allethrin [(1R) -isomer])、[c-4. 3] ビフェントリン (bifenthrin)、[c-4. 4] ビオアレスリン (bioallethrin)、[c-4. 5] ビオアレスリン S-シクロペンテニル アイソマー (bioallethrin S-cyclopentenyl isomer)、[c-4. 6] ビオレスメトリン (bioresmethrin)、[c-4. 7] シクロプロトリン (cycloprothrin)、[c-4. 8] シフルトリン (cyfluthrin)、[c-4. 9] ベーターシフルトリン (beta-cyfluthrin)、[c-4. 10] シハロトリン (cyhalothrin)、[c-4. 11] ガンマーシハロトリン (gamma-cyhalothrin)、[c-4. 12] ラムダーシハロトリン (lambda-cyhalothrin)、[c-4. 13] シペルメトリン (cypermethrin)、[c-4. 14] アルファシペルメトリン (alpha-cypermethrin)、[c-4. 15] ベーターシペルメトリン (beta-cypermethrin)、[c-4. 16] セターシペルメトリン (theta-cypermethrin)、[c-4. 17] ゼダーシペルメトリン (zeta-cypermethrin)、[c-4. 18] シフェノトリン [(1R) -トランス-アイソマー] (cyphenothrin [(1R) -trans-isomer])、[c-4. 19] デルタメトリン (deltamethrin)、[c-4. 20] エンペントリン [(EZ) - (1R) -アイソマー] (empenthrin [(EZ) - (1R) -isomer])、[c-4. 21] エスフェンバレレート (esfenvalerate)、[c-4. 22] エトフェンプロックス (ethofenprox)、[c-4. 23] フェンプロパトリン (fe

npropathrin)、[c-4. 24] フェンバレレート (fenv
alerate)、[c-4. 25] フルシトリネート (flucythr
inate)、[c-4. 26] フルメトリン (flumethrin)、
[c-4. 27] タウフルバリネート (tau-fluvalinate
)、[c-4. 28] ハルフェンプロックス (halfenprox)、[
c-4. 29] イミプロトリン (imiprothrin)、[c-4. 3
0] メトトリン (methothrin)、[c-4. 31] メトフルトリ
ン (metofluthrin)、[c-4. 32] イプシロン-メトフル
トリン (epsilon-metofluthrin)、[c-4. 33]
モンフルオロトリン (momfluorothrin)、[c-4. 34]
イプシロン-モンフルオロトリン (epsilon-momfluorot
hrin)、[c-4. 35] ペルメトリン (permethrin)、[
c-4. 36] フェノトリン [(1R) -トランス-アイソマー] (phe
nothrin [(1R) -trans-isomer])、[c-4. 3
7] プラレトリン (prallethrin)、[c-4. 38] レスメト
リン (resmethrin)、[c-4. 39] カデトリン (kadet
hrin)、[c-4. 40] シラフルオフエン (silafluofen
)、[c-4. 41] テフルトリン (tefluthrin)、[c-4.
42] テトラメトリン (tetramethrin)、[c-4. 43] テ
トラメトリン [(1R) -アイソマー] (tetramethrin [(1
R) -isomer])、[c-4. 44] トラロメトリン (tralom
ethrin)、[c-4. 45] トランスフルトリン (transflu
thrin)、[c-4. 46] ZX18901 (3-(4-bromop
henoxy) phenyl] -cyanomethyl 4-(diflu
oromethoxy) - α -(1-methylethyl) benze
neacetate)、[c-4. 47] バイオペルメトリン (biope
rmethrin)、[c-4. 48] フラメトリン (furamethr
in)、[c-4. 49] プロフルトリン (profluthrin)、[

c-4. 50] フルプロシトリネート (flubrocycythrinate)、[c-4. 51] ジメフルトリン (dimefluthrin)、[c-4. 52] DDT (dichloro-diphenyl-trichloroethane)、[c-4. 53] メトキシクロル (methoxychlor)、[c-4. 54] フェノトリン (phenothrin)、[c-4. 55] フルバリネート (fluvalinate) 等が挙げられる。

[1016] c-5 : ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) 競合的モジュレーター

ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) 競合的モジュレーターとして、[c-5. 1] アセタミプリド (acetamiprid)、[c-5. 2] クロチアニジン (clothianidin)、[c-5. 3] ジノテフラン (dinotefuran)、[c-5. 4] イミダクロプリド (imidacloprid)、[c-5. 5] ニテンピラム (nitenpyram)、[c-5. 6] チアクロプリド (thiacloprid)、[c-5. 7] チアメトキサム (thiamethoxam)、[c-5. 8] ニコチン (nicotine)、[c-5. 9] 硫酸ニコチン (nicotine sulfate)、[c-5. 10] スルホキサフロル (sulfoxaflor)、[c-5. 11] フルピラジフロン (flupyradifurone)、[c-5. 12] トリフルメゾピリム (triflumezopyrim) 等が挙げられる。

[1017] c-6 : ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) アロステリックモジュレーター

ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) アロステリックモジュレーターとして、[c-6. 1] スピノサド (spinosad)、[c-6. 2] スピネトラム (spinetoram) 等が挙げられる。

[1018] c-7 : グルタミン酸作動性塩素イオンチャネル (GluCl) アロステリックモジュレーター

グルタミン酸作動性塩素イオンチャネル (GluCl) アロステリックモジュレーターとして、[c-7. 1] アバメクチン (abamectin)、[c-7. 2] エマメクチン安息香酸塩 (emamectin benzoate)、[c-7. 3] レピメクチン (lepimectin)、[c-7. 4] ミルベメクチン (milbemectin) 等が挙げられる。

[1019] c-8 : 幼若ホルモン類似剤

幼若ホルモン類似剤として、[c-8. 1] ヒドロpren (hydroprene)、[c-8. 2] キノpren (kinoprene)、[c-8. 3] メトpren (methoprene)、[c-8. 4] フェノキシカルブ (fenoxycarb)、[c-8. 5] ピリプロキシフェン (pyriproxyfen) 等が挙げられる。

[1020] c-9 : 非特異的 (マルチサイト) 阻害剤

非特異的 (マルチサイト) 阻害剤として、[c-9. 1] 臭化メチル (methyl bromide)、[c-9. 2] クロロピクリン (chloropicrin)、[c-9. 3] クリオライト (cryolite)、[c-9. 4] フッ化スルフリル (sulfuryl fluoride)、[c-9. 5] ホウ砂 (borax)、[c-9. 6] ホウ酸 (boric acid)、[c-9. 7] オクタホウ酸二ナトリウム塩 (disodium octaborate)、[c-9. 8] メタホウ酸ナトリウム塩 (sodium metaborate) [c-9. 9] 吐酒石 (tartar emetic)、[c-9. 10] ダゾメット (dazomet)、[c-9. 11] メタム (metam)、[c-9. 12] カーバムナトリウム塩 (metham sodium) 等が挙げられる。

[1021] c-10 : 弦音器官TRPVチャネルモジュレーター

弦音器官TRPVチャネルモジュレーターとして、[c-10. 1] ピメトロジン (pymetrozine)、[c-10. 2] ピリフルキナゾン (pyrifluquinazon) 等が挙げられる。

[1022] c-11 : ダニ類成長阻害剤

ダニ類成長阻害剤として、[c-11. 1] クロフェンテジン (clofentazine)、[c-11. 2] ジフロビダジン (diflovidazin)、[c-11. 3] ヘキシチアゾクス (hexythiazox)、[c-11. 4] エトキサゾール (etoxazole) 等が挙げられる。

[1023] c-12 : ミトコンドリアATP合成酵素阻害剤

ミトコンドリアATP合成酵素阻害剤として、[c-12. 1] ジアフェンチウロン (diafenthion)、[c-12. 2] アゾシクロチン (azocyclotin)、[c-12. 3] シヘキサチン (cyhexatin)、[c-12. 4] フェンブタチンオキシド (fenbutatin oxide)、[c-12. 5] プロパルギット (propargite)、[c-12. 6] テトラジホン (tetradifon) 等が挙げられる。

[1024] c-13 : プロトン勾配を攪乱する酸化的リン酸化脱共役剤

プロトン勾配を攪乱する酸化的リン酸化脱共役剤として、[c-13. 1] クロルフェナピル (chlorfenapyr)、[c-13. 2] DNOC (dinitro-ortho-cresol)、[c-13. 3] ビナパクリル (binapacryl)、[c-13. 4] スルフルアミド (sulfluramid) 等が挙げられる。

[1025] c-14 : ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) チャネルブロッカー

ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) チャネルブロッカーとして、[c-14. 1] ベンスルタップ (bensultap)、[c-14. 2] カルタップ塩酸塩 (cartap hydrochloride)、[c-14. 3] チオシクラム (thiocyclam)、[c-14. 4] モノスルタップ (monosultap) 等が挙げられる。

[1026] c-15 : キチン生合成阻害剤タイプ0

キチン生合成阻害剤タイプ0として、[c-15. 1] ビストリフルロン

(b i s t r i f l u r o n)、[c-15. 2] クロルフルアズロン (c h l o r f l u a z u r o n)、[c-15. 3] ジフルベンズロン (d i f f l u b e n z u r o n)、[c-15. 4] フルシクロクスロン (f l u c y c l o x u r o n)、[c-15. 5] フルフェノクスロン (f l u f e n o x u r o n)、[c-15. 6] ヘキサフルムロン (h e x a f l u m u r o n)、[c-15. 7] ルフェヌロン (l u f e n u r o n)、[c-15. 8] ノバルロン (n o v a l u r o n)、[c-15. 9] ノビフルムロン (n o v i f l u m u r o n)、[c-15. 10] テフルベンズロン (t e f l u b e n z u r o n)、[c-15. 11] トリフルムロン (t r i f l u m u r o n) 等が挙げられる。

[1027] c-16 : キチン生合成阻害剤タイプ1

キチン生合成阻害剤タイプ1として、[c-16. 1] ブプロフェジン (b u p r o f e z i n) 等が挙げられる。

[1028] c-17 : ハエ目昆虫脱皮阻害剤

ハエ目昆虫脱皮阻害剤として、[c-17. 1] シロマジン (c y r o m a z i n e) 等が挙げられる。

[1029] c-18 : 脱皮ホルモン (エクダイソン) 受容体アゴニスト

脱皮ホルモン (エクダイソン) 受容体アゴニストとして、[c-18. 1] クロマフェノジド (c h r o m a f e n o z i d e)、[c-18. 2] ハロフェノジド (h a l o f e n o z i d e)、[c-18. 3] メトキシフェノジド (m e t h o x y f e n o z i d e)、[c-18. 4] テブフェノジド (t e b u f e n o z i d e) 等が挙げられる。

[1030] c-19 : オクトパミン受容体アゴニスト

オクトパミン受容体アゴニストとして、[c-19. 1] アミトラズ (a m i t r a z) 等が挙げられる。

[1031] c-20 : ミトコンドリア電子伝達系複合体III阻害剤

ミトコンドリア電子伝達系複合体III阻害剤として、[c-20. 1] ヒドラメチルノン (h y d r a m e t h y l n o n)、[c-20. 2] アセキ

ノシル (acequinocyl)、[c-20.3] フルアクリピリム (fluacrypyrim)、[c-20.4] ビフェナゼート (bifenazate) 等が挙げられる。

[1032] c-21 : ミトコンドリア電子伝達系複合体 I 阻害剤 (MET I)

ミトコンドリア電子伝達系複合体 I 阻害剤 (MET I) として、[c-21.1] フェナザキン (fenazaquin)、[c-21.2] フェンピロキシメート (fenpyroximate)、[c-21.3] ピリダベン (pyridaben)、[c-21.4] ピリミジフェン (pylimidifen)、[c-21.5] テブフェンピラド (tebufenpyrad)、[c-21.6] トルフエンピラド (tolfenpyrad)、[c-21.7] ロテノン (rotenone) 等が挙げられる。

[1033] c-22 : 電位依存性ナトリウムチャネルブロッカー

電位依存性ナトリウムチャネルブロッカーとして、[c-22.1] インドキサカルブ (indoxacarb)、[c-22.2] メタフルミゾン (metaflumizone) 等が挙げられる。

[1034] c-23 : アセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤

アセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤として、[c-23.1] スピロジクロフェン (spirodiclofen)、[c-23.2] スピロメシフェン (spiromesifen)、[c-23.3] スピロテトラマト (spirotetramat) 等が挙げられる。

[1035] c-24 : ミトコンドリア電子伝達系複合体IV阻害剤

ミトコンドリア電子伝達系複合体IV阻害剤として、[c-24.1] リン化アルミニウム (aluminum phosphide)、[c-24.2] リン化カルシウム (calcium phosphide)、[c-24.3] リン化水素 (phosphine)、[c-24.4] リン化亜鉛 (zinc phosphide)、[c-24.5] シアン化カルシウム (calcium cyanide)、[c-24.6] シアン化ナトリウム (potassium cyanide)、[c-24.7] シアン化カ

リウム (sodium cyanide) 等が挙げられる。

[1036] c-25 : ミトコンドリア電子伝達系複合体II阻害剤

ミトコンドリア電子伝達系複合体II阻害剤として、[c-25. 1] シエノピラフェン (cyenopyrafen)、[c-25. 2] シフルメトフェン (cyflumetofen)、[c-25. 3] ピフルブミド (pyflubumide) 等が挙げられる。

[1037] c-26 : リアノジン受容体モジュレーター

リアノジン受容体モジュレーターとして、[c-26. 1] クロラントラニリプロール (chlorantraniliprole)、[c-26. 2] シアントラニリプロール (cyantraniliprole)、[c-26. 3] フルベンジアミド (flubendiamide) 等が挙げられる。

[1038] c-27 : 標的部位未特定の弦音器官モジュレーター

標的部位未特定の弦音器官モジュレーターとして、[c-27. 1] フロニカミド (flonicamid) 等が挙げられる。

[1039] c-28 : その他の殺虫剤

その他の殺虫剤として、[c-28. 1] アザジラクチン (azadirachtin)、[c-28. 2] ベンゾキシメート (benzoximate)、[c-28. 3] フェニソブロモレート (phenisobromolate)、[c-28. 4] キノメチオナート (chinomethionat)、[c-28. 5] ジコホル (dicofol)、[c-28. 6] ピリダリル (pyridalyl)、[c-28. 7] ブロモプロピレート (bromopropylate)、[c-28. 8] トリアザメート (triazamate)、[c-28. 9] ジシクラニル (dicyclanil)、[c-28. 10] ジノブトン (dinobuton)、[c-28. 11] ジノカップ (dinocap)、[c-28. 12] シアン化水素 (hydrogen cyanide)、[c-28. 13] ヨウ化メチル (methyl iodide)、[c-28. 14] カランジン (k

aranjin)、[c-28. 15] 塩化水銀 (mercury chloride)、[c-28. 16] メチルイソチオシアネート (methyl isothiocyanate)、[c-28. 17] ペンタクロロフェノール (pentachlorophenol)、[c-28. 18] ホスフィン (phosphine)、[c-28. 19] ピペロニル ブトキシド (piperonyl butoxide)、[c-28. 20] ポリナクチン複合体 (polynactins)、[c-28. 21] サバディラ (sabadilla)、[c-28. 22] スルコフロン塩 (スルコフロンソーナトリウム (sulcofuron-sodium))、[c-28. 23] トリブホス (tribufos)、[c-28. 24] アルドリン (aldrin)、[c-28. 25] アミジチオオン (amidithion)、[c-28. 26] アミドチオエート (amidothioate)、[c-28. 27] アミノカルブ (aminocarb)、[c-28. 28] アミトン (amiton)、[c-28. 29] アラマイト (aramite)、[c-28. 30] アチダチオン (athidathion)、[c-28. 31] アゾトエート (azothoate)、[c-28. 32] ポリスルフィドバリウム (barium polysulphide)、[c-28. 33] ベンクロチアズ (benclothiaz)、[c-28. 34] 5-(1, 3-ベンゾジオキソール-5-イル)-3-ヘキシルシクロヘキサ-2-エノン (5-(1, 3-benzodioxole-5-yl)-3-hexylcyclohexa-2-enone)、[c-28. 35] 1, 1-ビス(4-クロロフェニル)-2-エトキシエタノール (1, 1-bis(4-chlorophenyl)-2-ethoxyethanol)、[c-28. 36] ブトネート (butonate)、[c-28. 37] ブトピロノキシル (butopyronoxyl)、[c-28. 38] 2-(2-ブトキシエトキシ) エチル チオシアネート (2-(2-butoxyethoxy) ethyl thiocyanate)、[c-28. 39] カンフェクロル (camphechlor)

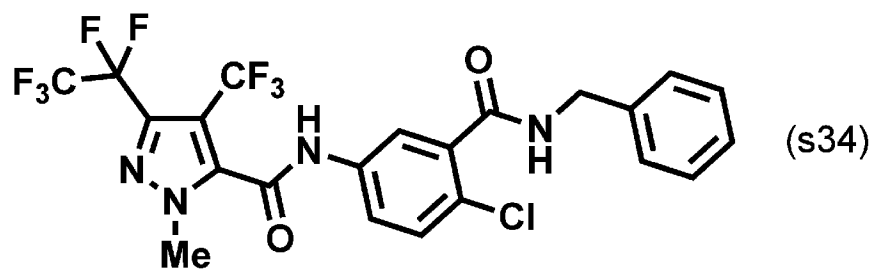
、[c-28. 40] クロルベンシド (chlorbenside)、[c-28. 41] クロルデコン (chlordecone)、[c-28. 42] クロルジメホルム (chlordimeform)、[c-28. 43] クロルフェネトール (chlorfenethol)、[c-28. 44] クロルフェンソン (chlorfenson)、[c-28. 45] フルアズロン (fluazuron)、[c-28. 46] メタアルデヒド (etaldehyde)、[c-28. 47] ビアラホス (bialaphos)、[c-28. 48] 塩酸レバミゾール (levamisol)、[c-28. 49] アミドフルメト (amidoflumet)、[c-28. 50] ピラフルプロール (pyrafluprole)、[c-28. 51] ピリプロール (pyriprole)、[c-28. 52] トラロピリル (tralopyril)、[c-28. 53] フルピラゾフォス (flupyrazofos)、[c-28. 54] ジオフェノラン (diofenolan)、[c-28. 55] クロルベンジレート (chlorobenzilate)、[c-28. 56] フルフェンジン (flufenzine)、[c-28. 57] ベンゾメート (benzomate)、[c-28. 58] フルフェネリム (flufenerim)、[c-28. 59] アルベンダゾール (albendazole)、[c-28. 60] オキシベンダゾール (oxibendazole)、[c-28. 61] フェンベンダゾール (fenbendazole)、[c-28. 62] メタム・ナトリウム (metam-sodium)、[c-28. 63] 1, 3-ジクロロプロペン (1, 3-dichloropropene)、[c-28. 64] フロメトキン (flometoquin)、[c-28. 65] シクラニリプロール (cyclaniliprole)、[c-28. 66] テトラニリプロール (tetraniliprole)、[c-28. 67] ブロフラニリド (broflanilide)、[c-28. 68] ジクロロメゾチアズ (dicloromezotiaz)、[c-28. 69] エチレンジブロマイド (ethylene dibromide)、[c-

28. 70] アクリロニトリル (acrylonitrile)、[c-28. 71] ビス (2-クロロエチル) エーテル (bis (2-chloroethyl) ether)、[c-28. 72] 1-ブロモ-2-クロロエタン (1-bromo-2-chloroethane)、[c-28. 73] 3-ブロモ-1-クロロプロパ-1-エン (3-bromo-1-chloroprop-1-ene)、[c-28. 74] ブロモシクレン (bromocyclen)、[c-28. 75] 二硫化炭素 (carbon disulfide)、[c-28. 76] 四塩化炭素 (tetrachloromethane)、[c-28. 77] ネマデクチン (nemadectin)、[c-28. 78] シミアゾール (cymiazole) [c-28. 79] カルシウム ポリスルフィド (calcium polysulfide)、[c-28. 80] サイトカニン (cytokinin)、[c-28. 81] 2- (オクチルチオ) エタノール、[c-28. 82] オレイン酸カリウム (potassium oleate)、[c-28. 83] オレイン酸ナトリウム (sodium oleate)、[c-28. 84] マシン油 (machine oil)、[c-28. 85] タール油 (tar oil)、[c-28. 86] アナバシン (anabasine)、[c-28. 87] 酒石酸モランテル (morantel tartrate)、[c-28. 88] 除虫菊 (ピレトリン (pyrethrum))、[c-28. 89] ナタネ油 (rape seed oil)、[c-28. 90] ダイズレチシン (soybean lecithin)、[c-28. 91] デンプン (starch)、[c-28. 92] ヒドロキシプロピルデンプン (hydroxypropylstarch)、[c-28. 93] 脂肪酸グリセリド (decanoyloctanoylglycerol)、[c-28. 94] プロピレングリコールモノ脂肪酸エステル (propylene glycol fatty acid ester)、[c-28. 95] ケイソウ土 (diatomite)、[c-28. 96] アフォキシラネル (afoxolaner)、[c-28. 9

7] フルアザインドリジン (fluaza indolizine)、[c-28. 98] アフィドピロペン (afidopyropen)、[c-28. 99] シハロジアミド (cyhalodiamide)、[c-28. 100] チオキサザフェン (thioxazafen)、[c-28. 101] フルヘキサフォン (fluhexafon)、[c-28. 102] フルララネル (fluralaner)、[c-28. 103] フルキサメタミド (fluxametamide)、[c-28. 104] テトラクロラントラニリプロール (tetrachlorantraniliprole)、[c-28. 105] サロラネル (sarolaner)、[c-28. 106] ロチラネル (lotilaner)、[c-28. 107] シクロキサプリド (cyclozaprid)、[c-28. 108] フルエンスルホン (fluen sulfone)、[c-28. 109] TPIC (tripropyl isocyanurate)、[c-28. 110] D-D (1, 3-Dichloropropene)、[c-28. 111] ペルオキシカルボナート (peroxocarbonate)、[c-28. 112] MB-599 (verbutin)、[c-28. 113] ビス (2, 3, 3, 3-テトラクロロプロピル) エーテル (bis (2, 3, 3, 3-tetrachloropropyl) ether)、[c-28. 114] DCIP (bis (2-chloro-1-methylethyl) ether)、[c-28. 115] ENT-8184 (N- (2-Ethylhexyl) bicyclo [2. 2. 1] hept-5-ene-2, 3-dicarboximide)、[c-28. 116] Bayer 22408 (O, O-diethyl O-naphthalimido phosphorothioate)、[c-28. 117] Bayer 32394 (tris (1-dodecyl-3-methyl-2-phenylbenzimidazolium) hexacyanoferrate)、

[1040] [c-28. 118] 式 (s34)

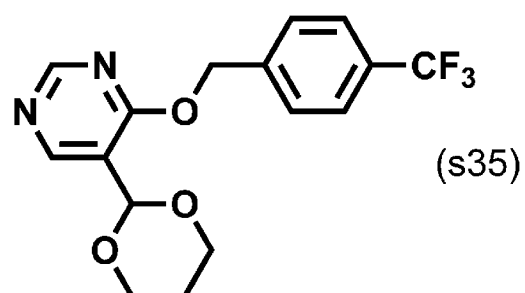
[化150]



で表される化合物（国際公開第10／051926号参照）、

[1041] [c-28. 119] 式 (s35)

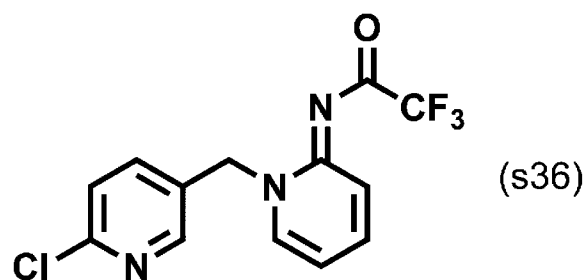
[化151]



で表される化合物（国際公開第13／115391号参照）、

[1042] [c-28. 120] 式 (s36)

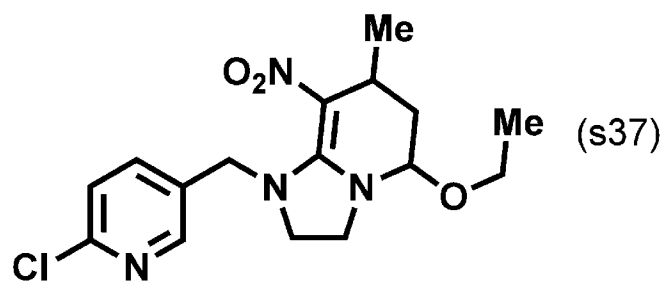
[化152]



で表される化合物（国際公開第12／029672号参照）、

[1043] [c-28. 121] 式 (s37)

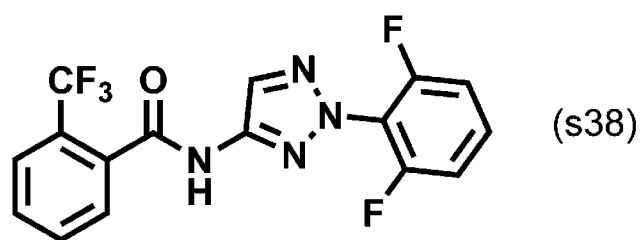
[化153]



で表される化合物（国際公開第06／056108号参照）、

[1044] [c-28. 122] 式 (s38)

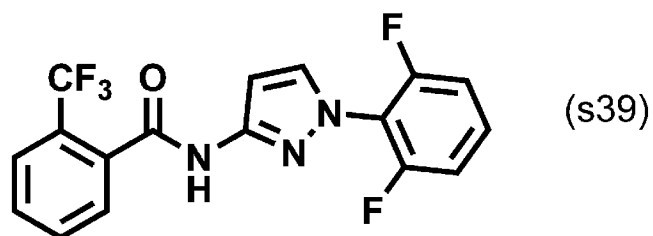
[化154]



で表される化合物（国際公開第14／053450号、国際特許第15／144683号参照）、

[1045] [c-28. 123] 式 (s39)

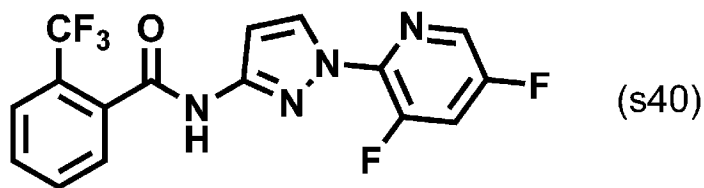
[化155]



で表される化合物（国際公開第14／053450号、国際特許第15／144683号参照）、

[1046] [c-28. 124] 式 (s40)

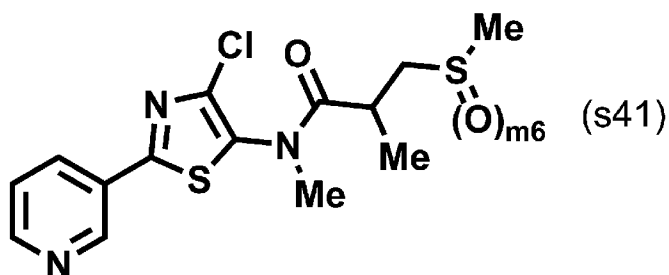
[化156]



で表される化合物（国際公開第 1 4 / 0 5 3 4 5 0 号、国際特許第 1 5 / 1 4 4 6 8 3 号参照）、

[1047] [c-28. 125] 式 (s41)

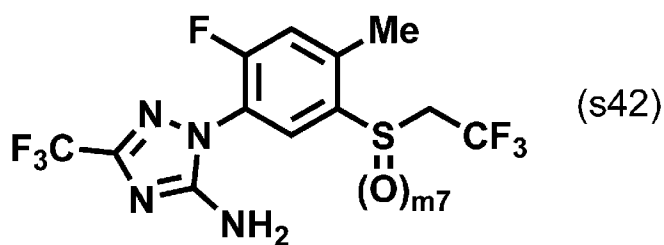
[化157]



[式中、m6は、0～2の整数を表す。] で表される化合物（国際公開第 1 0 / 1 2 9 4 9 7 号参照）、

[1048] [c-28. 126] 式 (s42)

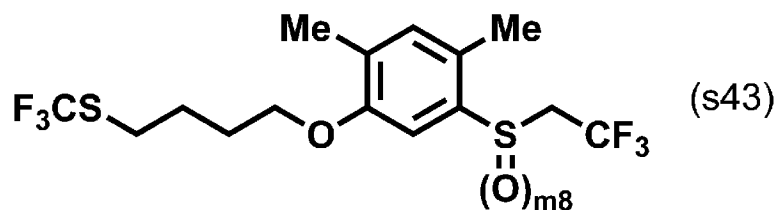
[化158]



[式中、m7は、0～2の整数を表す。] で表される化合物（国際公開第 1 1 / 1 5 2 3 2 0 号参照）、

[1049] [c-28. 127] 式 (s43)

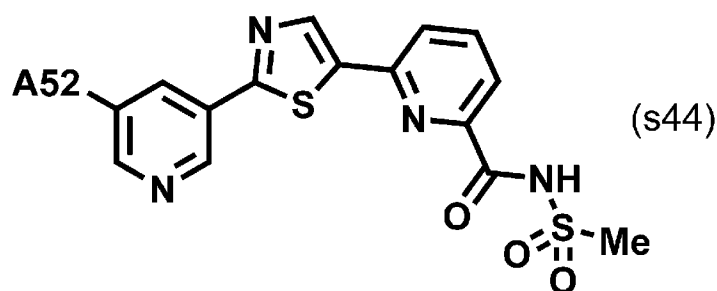
[化159]



[式中、m 8は、0～2の整数を表す。] で表される化合物（特開平27－160813号公報参照）、

[1050] [c－28. 128] 式(s44)

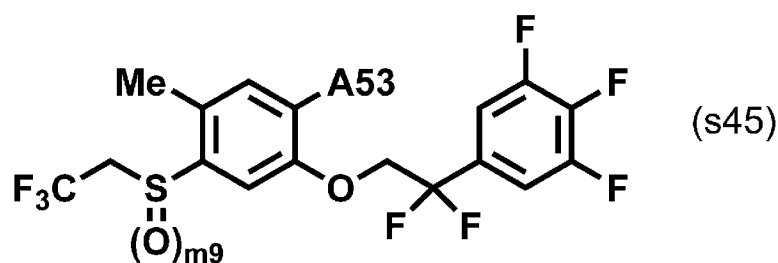
[化160]



[式中、A 52は、水素原子、またはフッ素原子を表す。] で表される化合物（国際公開第11／134964号、国際特許第14／005982号参照）、

[1051] [c－28. 129] 式(s45)

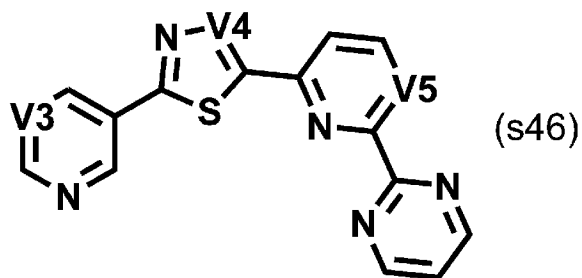
[化161]



[式中、m 9は、0～2の整数を表し、A 53は、フッ素原子、または塩素原子を表す。] で表される化合物（国際公開第15／025826号参照）、

[1052] [c－28. 130] 式(s46)

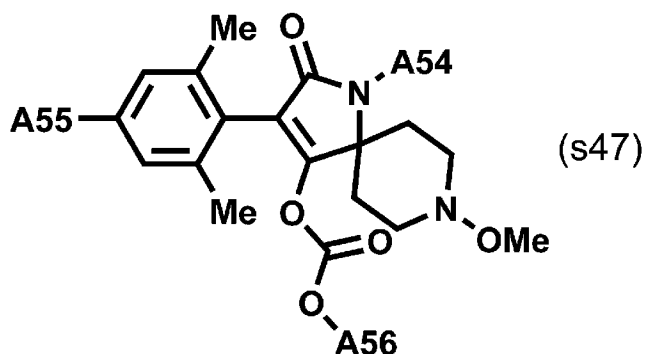
[化162]



[式中、V3は、窒素原子、炭素原子、またはC-Fを表し、V4およびV5は、それぞれ独立して、窒素原子、または炭素原子を表す。]で表される化合物（国際公開第11/134964号、国際公開第14/005982号参照）、

[1053] [c-28.131]式(s47)

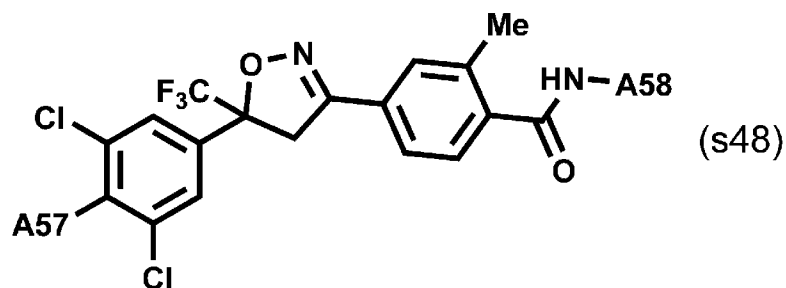
[化163]



[式中、A54は、水素原子、メチル基、メトキシ基、またはエトキシ基を表し、A55は、塩素原子、またはメチル基を表し、A56は、メチル基、またはエチル基を表す。]で表される化合物（国際公開第09/049851号参照）、

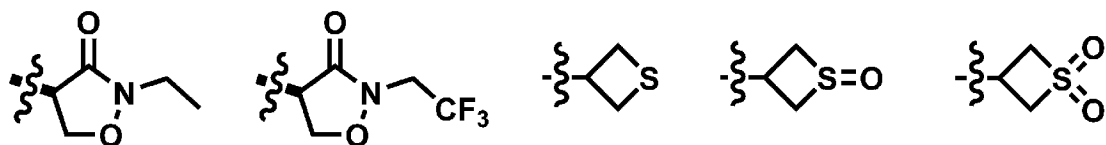
[1054] [c-28.132]式(s48)

[化164]



[式中、A 5 7 は、水素原子、フッ素原子、または塩素原子を表し、A 5 8 は、

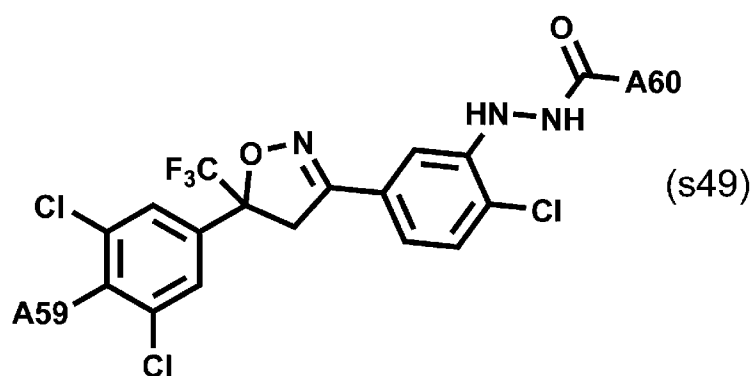
[化165]



からなる群から選択される 1 種の部分構造を表す。] で表される化合物（国際公開第 1 1 / 0 6 7 2 7 2 号参照）、

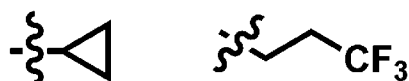
[1055] [c - 2 8 . 1 3 3] 式 (s 4 9)

[化166]



[式中、A 5 9 は、水素原子、フッ素原子、または塩素原子を表し、A 6 0 は、

[化167]

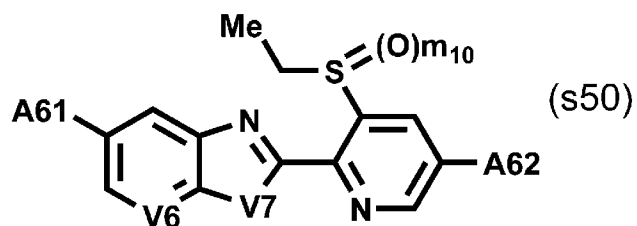


からなる群から選択される部分構造を表す。] で表される化合物（国際公開

第10/090344号参照)、

[1056] [c-28.134] 式(s50)

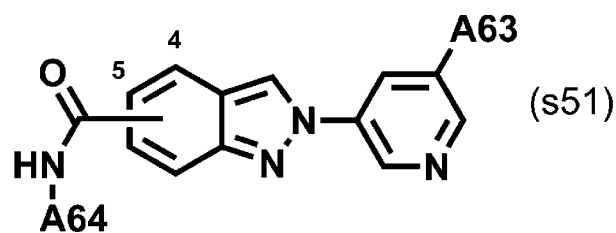
[化168]



[式中、m10は、0～2の整数を表し、A61は、トリフルオロメチル基、トリフルオロメチルチオ基、トリフルオロメチルスルフィニル基、またはトリフルオロメチルスルホニル基を表し、A62は、水素原子、またはトリフルオロメチル基を表し、V6は、窒素原子、または炭素原子を表し、V7は、酸素原子、またはN-メチル基を表す。]で表される化合物(国際公開第14/104407号参照)、

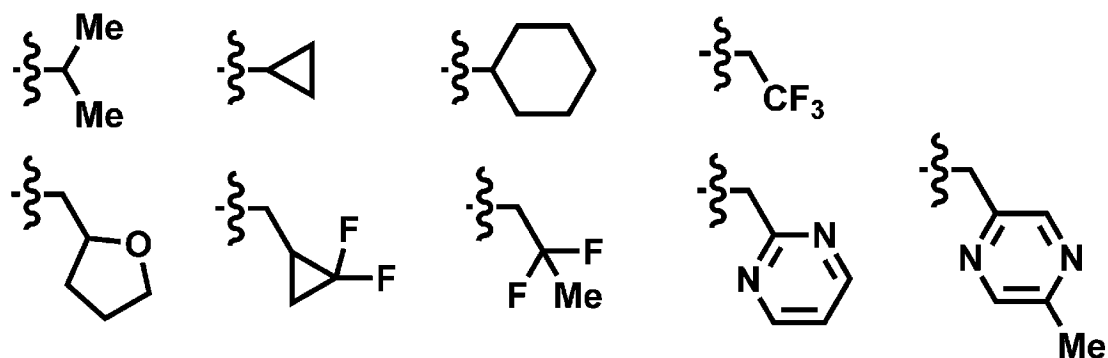
[1057] [c-28.135] 式(s51)

[化169]



[式中、A63は、水素原子、またはフッ素原子を表し、アミド基は4位、または5位に結合し、A64は、

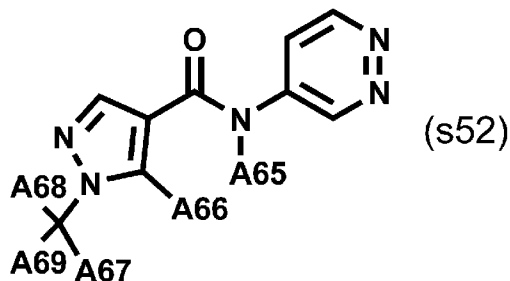
[化170]



からなる群から選択される部分構造を表す。] で表される化合物（国際公開第 15/038503 号、国際特許第 16/144351 号、国際特許第 16/144678 号参照）、

[1058] [c-28. 136] 式 (s52)

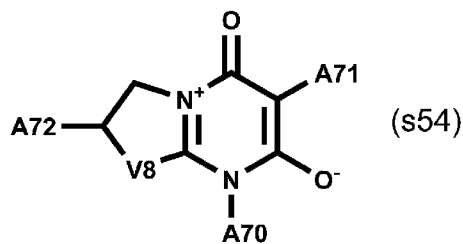
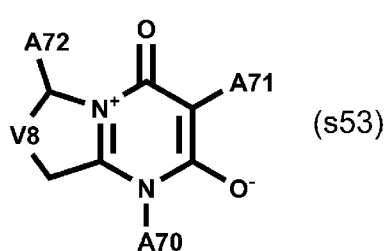
[化171]



[式中、A65は、水素原子、C1～C6のアルキル基、またはC1～C6のハロアルキル基を表し、A66は、水素原子、ハロゲン原子、またはC1～C6のアルキル基を表し、A67およびA68は、それぞれ独立して、水素原子、シアノ基で適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、メトキシ基で適宜置換されてもよいアルキル基、エトキシ基で適宜置換されてもよいアルキル基、またはC3～C8のシクロアルキル基を表し、A69は、水素原子、シアノ基、シアノ基で適宜置換されてもよいC1～C6のハロアルキル基、C1～C6のアルキル基、またはC3～C8のシクロアルキル基を表す。] で表される化合物（国際公開第 12/143317 号、国際特許第 16/016369 号参照）、

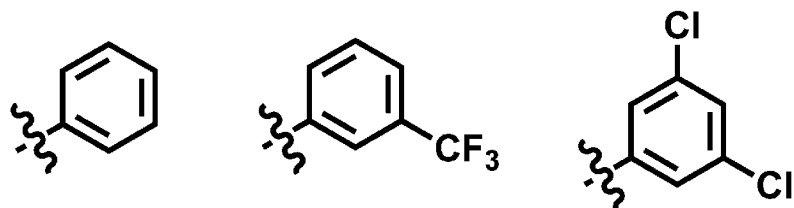
[1059] [c-28. 137] 式 (s53) または式 (s54)

[化172]



[式中、A70は、メチル基、エチル基、イソプロピル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、またはフェニル基を表し、A71は、

[化173]



からなる群から選択される部分構造を表し、A 7 2 は、

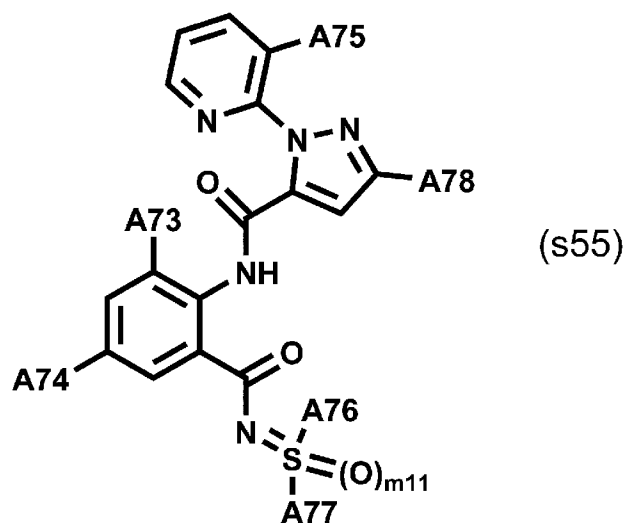
[化174]



からなる群から選択される部分構造を表し、V 8 は、酸素原子、硫黄原子、
 $-CH_2-$ 、または $-CH_2CH_2-$ を表す。] で表される化合物（国際公開第
 1 4 / 1 6 7 0 8 4 号、国際特許第 1 6 / 0 5 5 4 3 1 号参照）、

[1060] [c-28. 138] 式 (s55)

[化175]

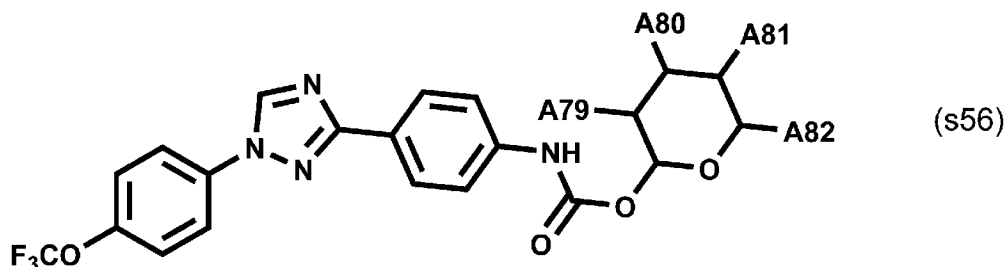


[式中、m 1 1 は、0 ~ 1 の整数を表し、A 7 3 は、塩素原子、臭素原子、
 メチル基、またはトリフルオロメチル基を表し、A 7 4 は、水素原子、塩素
 原子、臭素原子、シアノ基、またはトリフルオロメチル基表し、A 7 5 は、
 水素原子、塩素原子または臭素原子を表し、A 7 6 および A 7 7 は、それぞ
 れ独立していて、C 1 ~ C 6 のアルキル基、または C 3 ~ C 8 のシクロアル

キル基を表し、A 7 8 は、塩素原子、臭素原子、シアノ基、ニトロ基、ジフルオロメチル基、またはトリフルオロメチル基を表す。] で表される化合物
(国際公開第 1 3 / 0 2 4 0 0 9 号参照)、

[1061] [c-28. 139] 式 (s56)

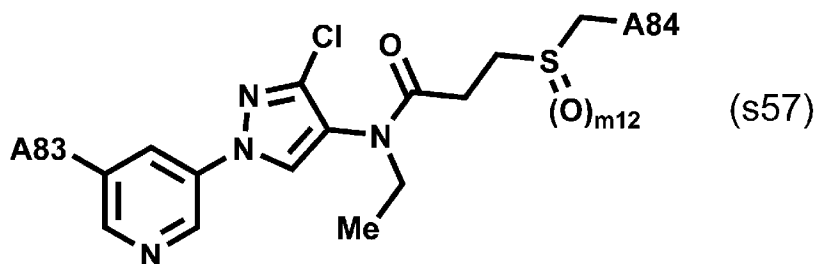
[化176]



[式中、A 7 9、A 8 0、A 8 1 および A 8 2 は、それぞれ独立していて、水素原子、ハロゲン原子、C 1 ~ C 6 のアルキル基、C 1 ~ C 6 のハロアルキル基、C 1 ~ C 6 のアルコキシ基、または C 3 ~ C 8 のシクロアルコキシ基を表す。] で表される化合物 (国際公開第 1 2 / 0 2 7 5 2 1 号参照)、

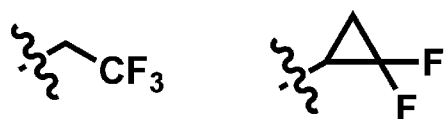
[1062] [c-28. 140] 式 (s57)

[化177]



[式中、m 1 2 は、0 ~ 2 の整数を表し、A 8 3 は、水素原子、またはフッ素原子を表し、A 8 4 は、

[化178]

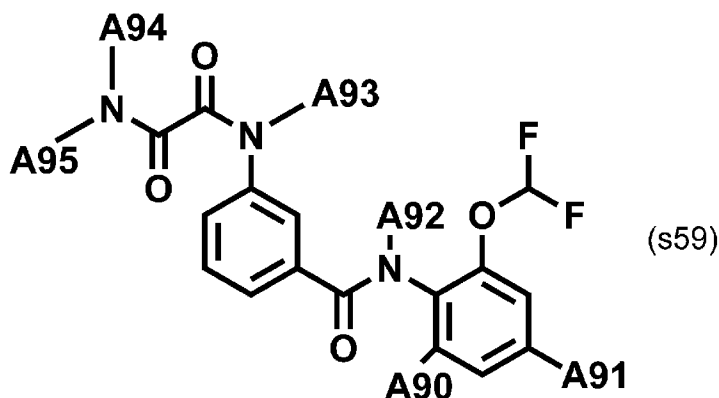


からなる群から選択される部分構造を表す。] で表される化合物 (国際公開第 1 3 / 1 6 2 7 1 5 号参照)、

[1063] [c-28.141] アシノナピル (acynonapyr)、

[1064] [c-28.142] 式 (s59)

[化179]



[A90は、ハロゲン原子、C1～C6のアルキル基、またはC1～C6のハロアルキル基を表し、A91は、C1～C6のハロアルキル基を表し、A92およびA93は、それぞれ独立して、水素原子、C1～C6のアルキル基、アセチル基、プロピオノイル基、メタンスルホニルエチル基、メトキシカルボニル基、またはエトキシカルボニル基を表し、A94およびA95は、それぞれ独立して、水素原子、C1～C6のアルキル基、またはC1～C6のハロアルキル基を表す。]で表される化合物（国際公開第12／164698号参照）等が挙げられる。

[1065] 本発明化合物と有害生物防除剤の混合比は、効果が発揮される限りにおいて特に制限されるものではないが、通常、本発明化合物に対して有害生物防除剤が、重量比で0.001～1000の比率であり、好ましくは、0.01～100の比率である。

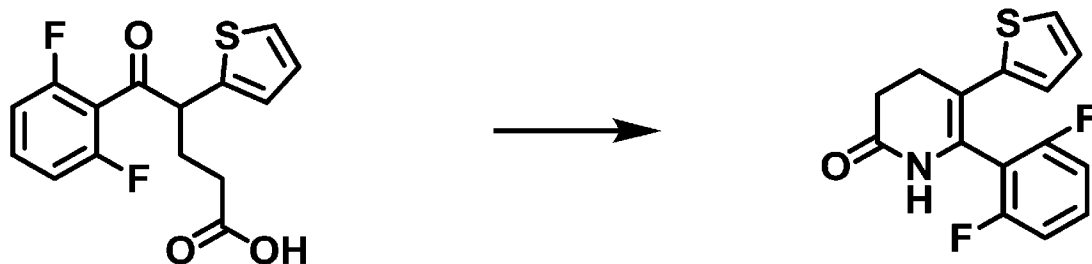
実施例

[1066] 以下に、合成例、参考例、および試験例を挙げて、本発明を更に詳細に示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

[1067] [合成例1]

ステップ1：6-（2，6-ジフルオロフェニル）-5-（チオフェン-2-イル）-3，4-ジヒドロピリジン2（1H）-オンの合成

[化180]

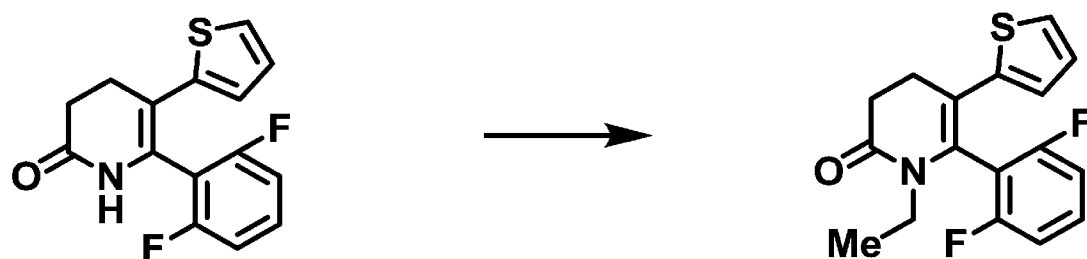


[1068] 参考例3で得られた5-(2,6-ジフルオロフェニル)-5-オキソ-4-(チオフェン-2-イル)ペンタン酸 8.64 gに、酢酸アンモニウム 107.31 gと酢酸 43 mlを加えて、100℃で4時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層に水を加え、次いで炭酸ナトリウムを加えて中和した。有機層と水層を分液した後に、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が4.98 gの黒褐色固体として得られた。

[1069] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.42 (1H, m), 7.06 (1H, m), 6.97 (2H, m), 6.86 (2H, m), 6.77 (1H, m), 2.99 (2H, m), 2.72 (2H, m).

[1070] ステップ2: 6-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-エチル-5-(チオフェン-2-イル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オンの合成 (化合物番号: 2)

[化181]



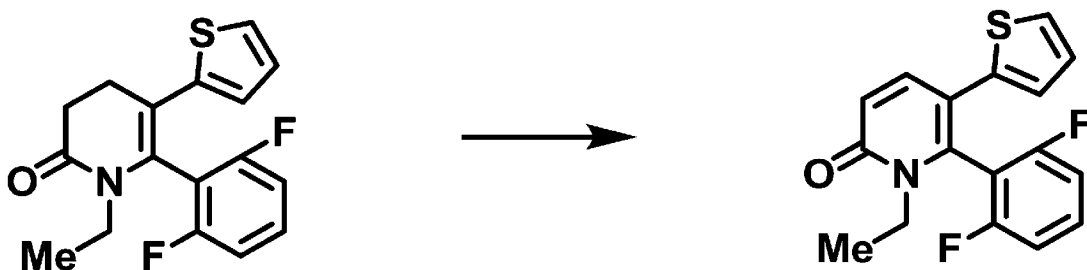
[1071] 6-(2,6-ジフルオロフェニル)-5-(チオフェン-2-イル)-

3, 4-ジヒドロピリジン 2 (1H)-オン 2.00 g、ヨウ化エチル 1.65 ml と炭酸セシウム 6.71 g を含む DMF 20 ml を 50℃ で 3 時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液と飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 1.92 g の褐色油状物として得られた。

[1072] [合成例 2]

6-(2, 6-ジフルオロフェニル)-1-エチル-5-(チオフェン-2-イル)ピリジン-2 (1H)-オンの合成 (化合物番号: 5)

[化182]

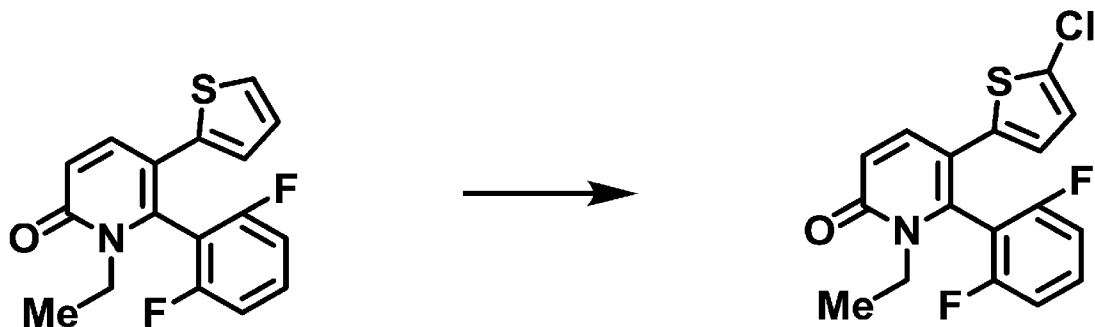


[1073] 6-(2, 6-ジフルオロフェニル)-1-エチル-5-(チオフェン-2-イル)-3, 4-ジヒドロピリジン-2 (1H)-オン 520 mg を含むジクロロメタン溶液 15 ml に、二酸化マンガン 7.08 g を加えて、加熱還流下で 16 時間攪拌した。さらに二酸化マンガン 3.54 g を加えて加熱還流下で 6 時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物をセライト濾過し、酢酸エチルで残渣を洗浄した。減圧下にて溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 212 mg の白色固体として得られた。

[1074] [合成例 3]

5-(5-クロロチオフェン-2-イル)-6-(2, 6-ジフルオロフェニル)-1-エチルピリジン-2 (1H)-オンの合成 (化合物番号: 6)

[化183]

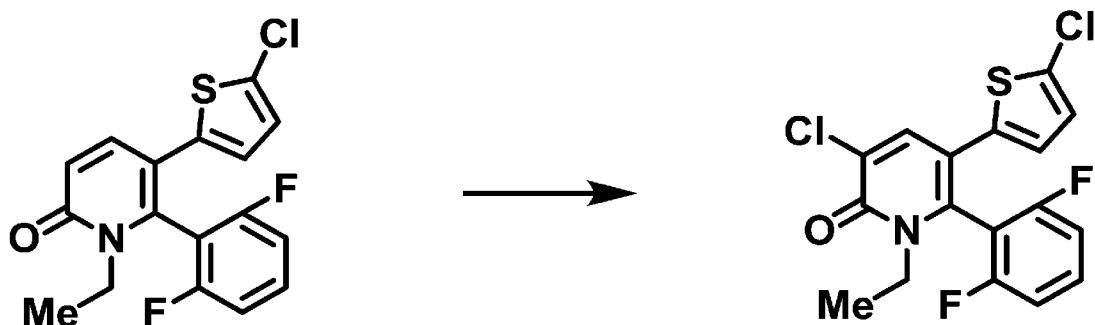


- [1075] 6-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-エチル-5-(チオフェン-2-イル)ピリジン-2(1H)-オン 85 mg と N-クロロスクシンイミド 39 mg を含む DMF 溶液 3 ml を 80℃ で 2 時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した後に、ジイソプロピルエーテルとヘキサンを混合した溶液にて析出物を洗浄した。表題の化合物が 66 mg の白色固体として得られた。

[1076] [合成例 4]

3-クロロ-5-(5-クロロチオフェン-2-イル)-6-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-エチルピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号: 7)

[化184]



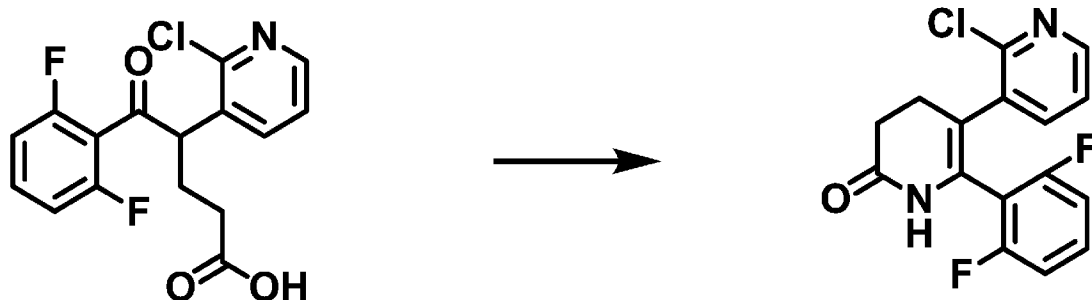
- [1077] 5-(5-クロロチオフェン-2-イル)-6-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-エチルピリジン-2(1H)-オン 97 mg と N-クロロスクシンイミド 41 mg を含む DMF 溶液 3 ml を 80℃ で 2 時間攪拌

した。さらに、N-クロロスクシンイミド 21 mg を加えて、120℃で5時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が32 mgの白色固体として得られた。

[1078] [合成例5]

ステップ1：2-クロロ-2-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-[3,3'-ビピリジン]-6(1H)-オンの合成

[化185]



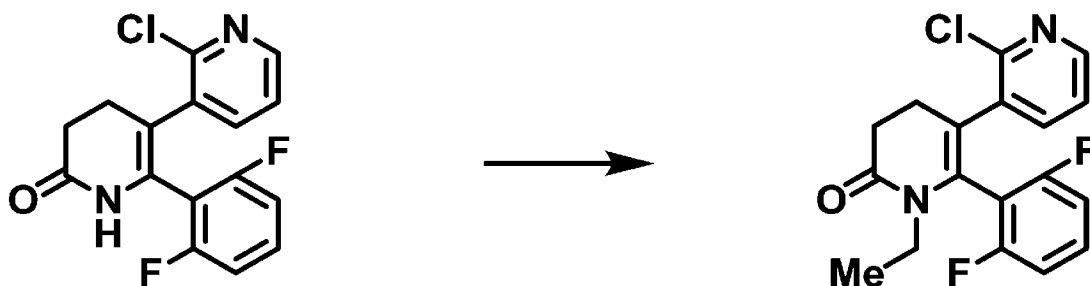
[1079] 参考例6で得られた4-(2-クロロピリジン-3-イル)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-5-オキソペンタン酸 280 mg に、酢酸アンモニウム 2.80 g と酢酸 5 ml を加えて、100℃で5時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層に水を加え、次いで炭酸カリウムを加えて中和した。有機層と水層を分液した後に、得られた有機層を水と飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が39.5 mgの茶色固体として得られた。

[1080] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.21 (1H, dd, $J = 4.7, 1.8$ Hz), 7.34 (1H, dd, $J = 7.6, 1.8$ Hz), 7.26–7.23 (1H, m), 7.02 (1H, dd, $J = 7.6, 4.7$ Hz), 6.8

3-6.81 (3H, m), 3.15-2.65 (4H, m).

[1081] ステップ2: 2-クロロ-2-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-エチル-4,5-ジヒドロ-[3,3'-ビピリジン]-6(1H)-オンの合成

[化186]



[1082] 2-クロロ-2-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-[3,3'-ビピリジン]-6(1H)-オン 39.5 mg、ヨウ化エチル 29.3 μ l と炭酸セシウム 120.2 mg を含む DMF 3 ml を 60°C で 3 時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を水と飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 37.5 mg の淡黄色固体として得られた。

[1083] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.17 (1H, dd, $J = 4.9, 1.8$ Hz), 7.37-7.35 (1H, m), 7.24-7.21 (1H, m), 6.99 (1H, dd, $J = 7.6, 4.9$ Hz), 6.82-6.77 (2H, m), 3.52-3.46 (1H, m), 3.41-3.33 (1H, m), 2.92-2.83 (2H, m), 2.75-2.69 (1H, m), 2.62-2.56 (1H, m), 0.99 (3H, t, $J = 7.2$ Hz).

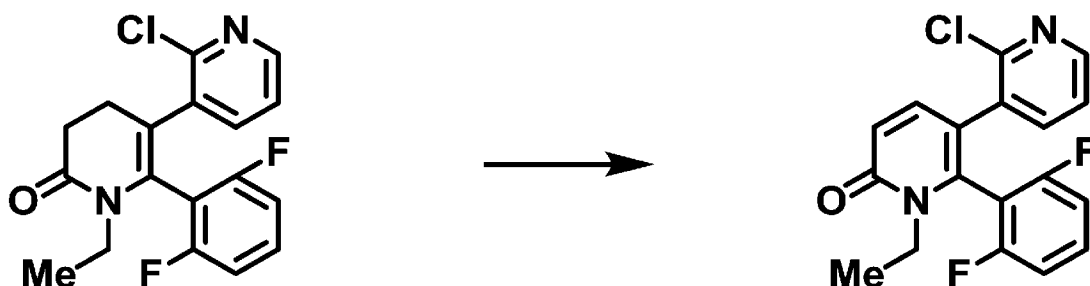
[1084] [合成例 6]

2-クロロ-2-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-エチル-[3,

3' -ビピリジン] - 6 (1 H) - オンの合成

(化合物番号 : 17)

[化187]

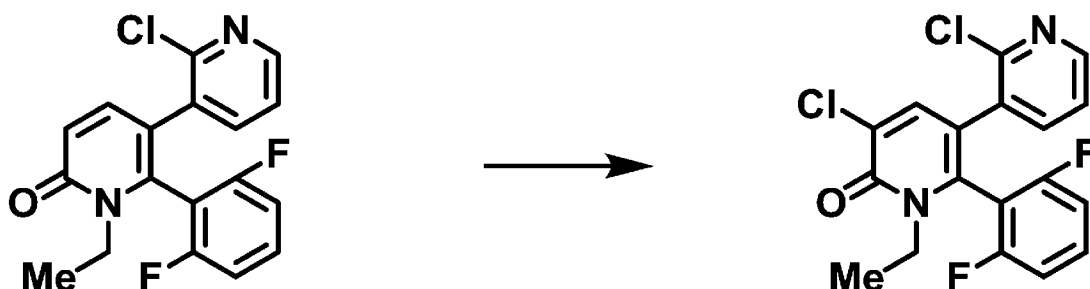


[1085] 2-クロロ-2-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-エチル-4,5-ジヒドロ-[3,3'-ビピリジン]-6(1H)-オン 37.5 mg を含む四塩化炭素溶液 3 ml に、N-ブロモスクシンイミド 20.1 mg とアゾビスイソブチロニトリル 1.8 mg を加えて、80℃で1時間攪拌した。室温まで冷却した後に、チオ硫酸ナトリウム水溶液を加えた。得られた反応混合物に水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去し、表題の化合物が32.3 mgの固体として得られた。

[1086] [合成例7]

2,5-ジクロロ-2-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-エチル-[3,3'-ビピリジン]-6(1H)-オンの合成 (化合物番号 : 18)

[化188]



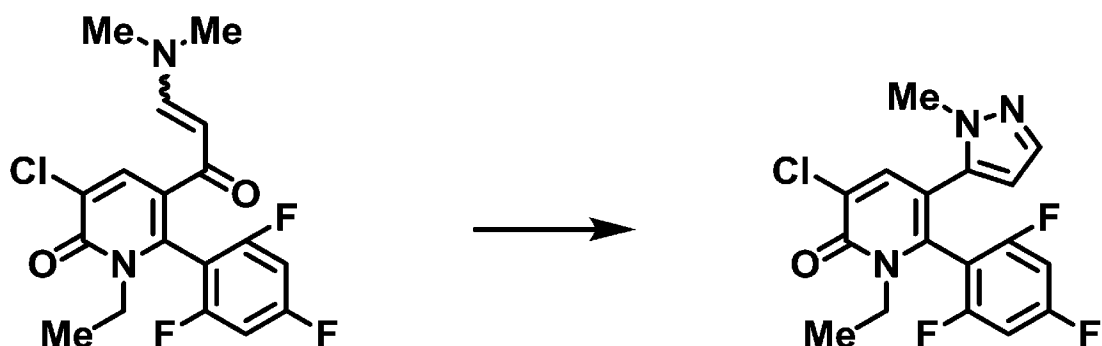
[1087] 2-クロロ-2-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-エチル-[3,3'-ビピリジン]-6(1H)-オン 12.3 mg と N-クロロスクシ

ンイミド 11.4 mg を含む DMF 溶液 3 ml を 60℃ で 10.5 時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を水と飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 10.7 mg の白色固体として得られた。

[1088] [合成例 8]

3-クロロ-1-エチル-5-(1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号: 20)

[化189]



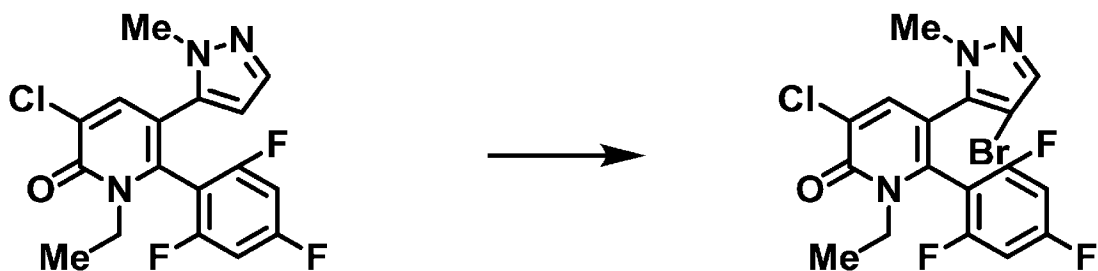
[1089] 参考例 16 で得られた 3-クロロ-5-(3-(ジメチルアミノ)アクリロイル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 400 mg、メチルヒドラジン 165 μ l を含むエタノール溶液 5 ml を 60℃ で 2 時間攪拌した。室温まで冷却した後に、1 規定塩酸と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 250 mg の黄色固体として得られた。

[1090] [合成例 9]

5-(4-ブロモ-1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)-3-クロロ-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-

2 (1H) -オンの合成 (化合物番号: 21)

[化190]

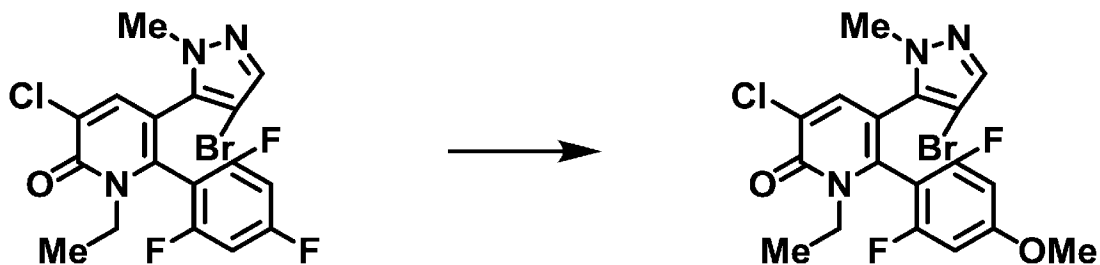


- [1091] 3-クロロ-1-エチル-5-(1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 100 mg、N-ブロモスクシンイミド 53 mgを含むDMF溶液 3 mlを60℃で2時間攪拌した。室温まで冷却した後に、水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が117 mgの白色固体として得られた。

[1092] [合成例10]

5-(4-ブromo-1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)-3-クロロ-6-(2,6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル)-1-エチルピリジン-2(1H)-オンの合成 (化合物番号: 23)

[化191]



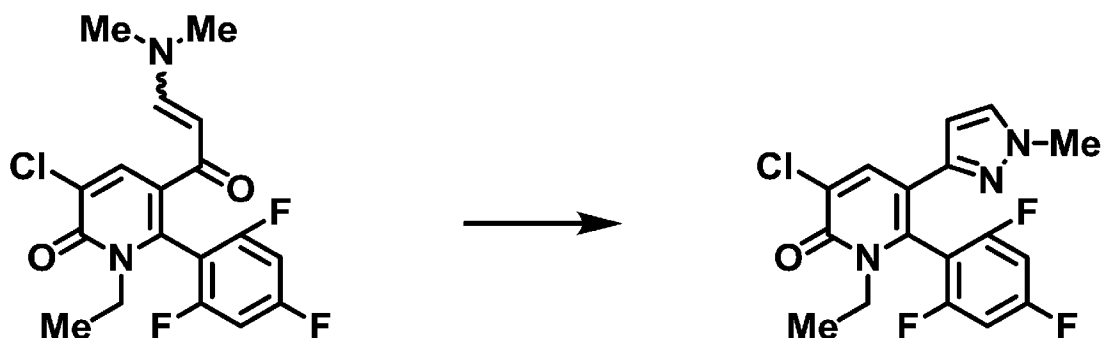
- [1093] 5-(4-ブromo-1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)-3-クロロ-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 69 mg、28%のナトリウムメトキシドのメタノール

溶液 149 μ l を含むメタノール溶液 3 ml を加熱還流下で5時間撹拌した。室温まで冷却した後に、水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が59 mg の白色固体として得られた。

[1094] [合成例 11]

ステップ1：3-クロロ-1-エチル-5-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成

[化192]



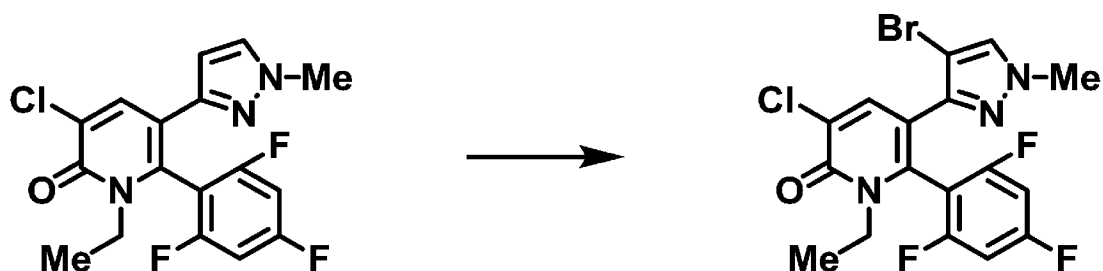
[1095] メチルヒドラジン 546 μ l を含むアセトン 4 ml を室温で1時間撹拌した。次いで、参考例16で得られた3-クロロ-5-(3-(ジメチルアミノ)アクリロイル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 400 mg を含むアセトン溶液 1 ml を加えて加熱還流下で3時間撹拌した。室温まで冷却した後に、減圧下で溶媒留去した。得られた反応混合物にエタノール 3 ml と濃塩酸0.5 ml を加えて60℃で8時間撹拌した。室温まで冷却した後に、水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が29 mg の黄色油状物として得られた。

[1096] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.09 (1H, s), 7.

1.4 (1H, d, J = 2.4 Hz), 6.81–6.79 (2H, m), 5.47 (1H, d, J = 2.4 Hz), 3.95 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.80 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).

[1097] ステップ2：5-(4-ブロモ-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-3-クロロ-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号：24)

[化193]

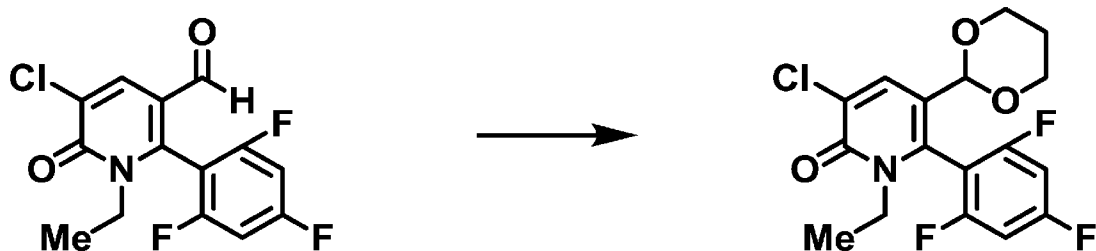


[1098] 3-クロロ-1-エチル-5-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 29 mg、N-ブロモスクシンイミド 15 mgを含むDMF溶液 2 mlを60℃で2時間攪拌した。室温まで冷却した後に、水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が29 mgの白色固体として得られた。

[1099] [合成例12]

3-クロロ-5-(1,3-ジオキサソ-2-イル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号：8)

[化194]

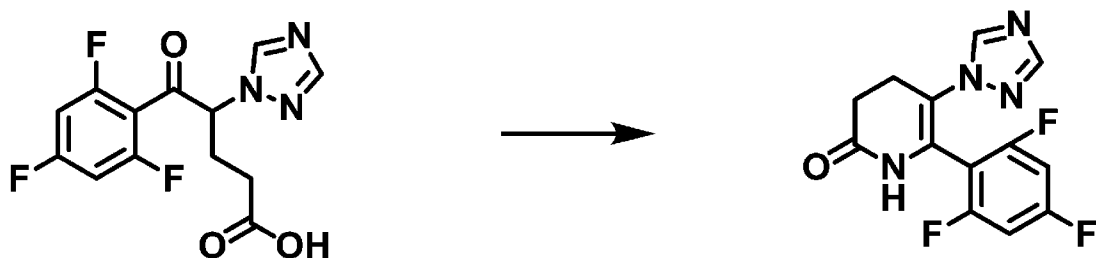


[1100] 参考例 13 で得られた 5-クロロ-1-エチル-6-オキソ-2-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-1, 6-ジヒドロピリジン-3-カルボアルデヒド 150 mg、1, 3-プロパンジオール 52 μ l、p-トルエンスルホン酸 1 水和物 8 mg を含むトルエン溶液 5 ml を加熱還流下で 4 時間攪拌した。室温まで冷却した後に、水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 153 mg の白色固体として得られた。

[1101] [合成例 13]

ステップ 1 : 5-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-3, 4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オンの合成

[化195]



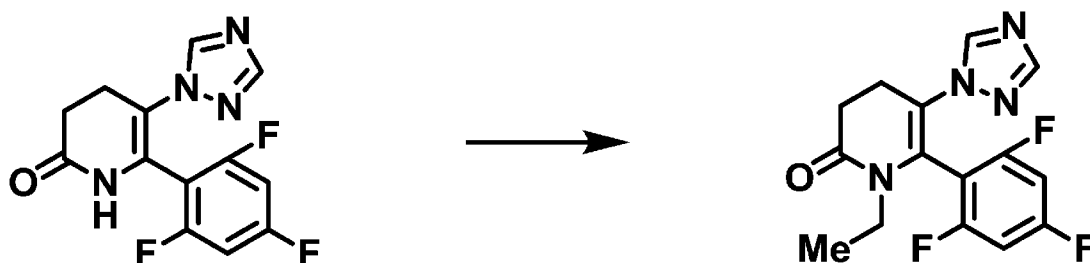
[1102] 5-オキソ-4-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)-5-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)ペンタン酸 914 mg に、酢酸アンモニウム 4.50 g と酢酸 9.14 ml を加えて、加熱還流下で 30 分間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウ

ム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が547mgの茶色固体として得られた。

[1103] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.92 (1H, s), 7.81 (1H, s), 6.84 (1H, s), 6.72–6.69 (2H, m), 3.06–3.05 (2H, m), 2.89–2.88 (2H, m).

[1104] ステップ2: 1-エチル-5-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オンの合成

[化196]



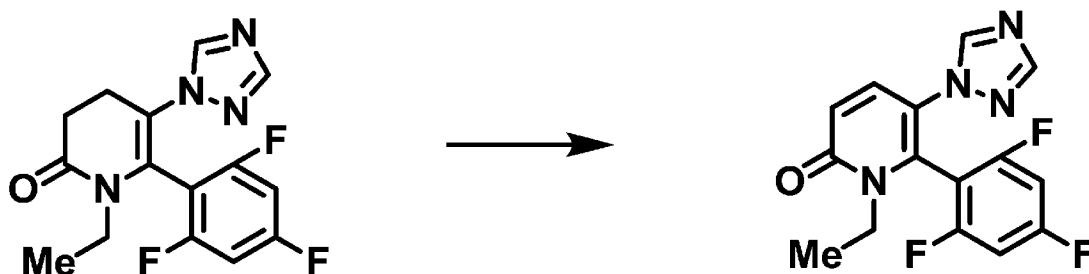
[1105] 5-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オン 547mg、ヨウ化エチル 446 μ lと炭酸セシウム 1.82gを含むDMF 5mlを50℃で1.5時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が482mgの白色固体として得られた。

[1106] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.87 (1H, s), 7.83 (1H, s), 6.71–6.68 (2H, m), 3.42 (2H, q, $J = 7.1 \text{ Hz}$), 2.90–2.89 (

4 H, m), 0.99 (3 H, t, $J = 7.1$ Hz).

[1107] ステップ3：1-エチル-5-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成

[化197]

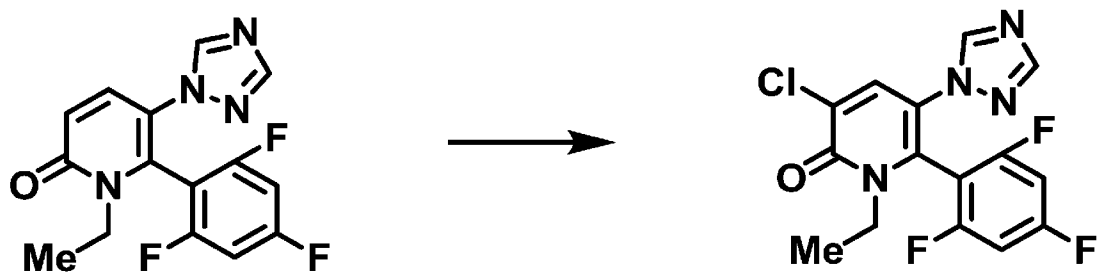


[1108] 1-エチル-5-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オン 482 mg、2,3-ジクロロ-5,6-ジシアノ-p-ベンゾキノン 1.02 gを含むトルエン溶液 5 mlを加熱還流下で5時間攪拌した。さらに反応混合物に、2,3-ジクロロ-5,6-ジシアノ-p-ベンゾキノン 340 mgを加えて、加熱還流下で4.5時間攪拌した。室温まで冷却した後に、減圧下で溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が97 mgの茶色固体として得られた。

[1109] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.99 (1 H, s), 7.86 (1 H, s), 7.42 (1 H, d, $J = 9.8$ Hz), 6.79 (1 H, d, $J = 9.8$ Hz), 6.75-6.73 (2 H, m), 3.89 (2 H, q, $J = 7.2$ Hz), 1.18 (3 H, t, $J = 7.2$ Hz).

[1110] ステップ4：3-クロロ-1-エチル-5-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成 (化合物番号：34)

[化198]

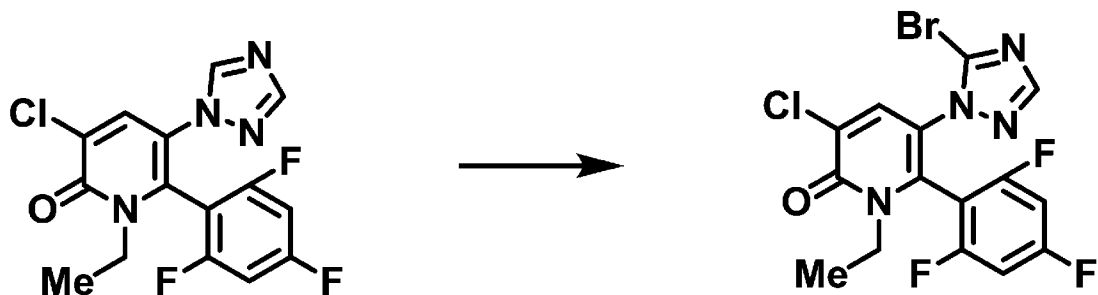


[1111] 1-エチル-5-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 97 mg、N-クロロスクシンイミド 49 mgを含むDMF溶液 3 mlを70℃で4時間攪拌した。さらに反応混合物にN-クロロスクシンイミド 32 mgを加えて、70℃で1時間攪拌した。室温まで冷却した後に、水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が86 mgの白色固体として得られた。

[1112] [合成例14]

5-(5-ブロモ-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)-3-クロロ-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号:35)

[化199]



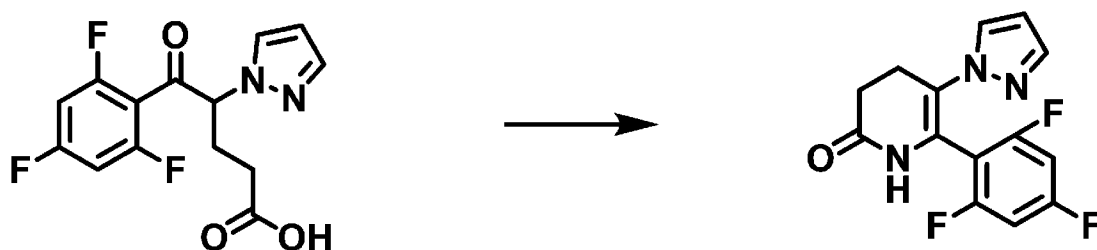
[1113] 3-クロロ-1-エチル-5-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 58 mgを含む四塩化炭素溶液 2 mlに、N-ブロモスクシンイ

ミド 35 mg とアゾビスイソブチロニトリル 5 mg を加えて、加熱還流下で2時間攪拌した。さらに、反応混合物にN-ブロモスクシンイミド 39 mg とアゾビスイソブチロニトリル 5.4 mg を加えて、加熱還流下で3.5時間攪拌した。室温まで冷却した後に、チオ硫酸ナトリウム水溶液を加えた。得られた反応混合物に水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去し、表題の化合物が34 mg の白色固体として得られた。

[1114] [合成例15]

ステップ1：5-(1H-ピラゾール-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オンの合成

[化200]



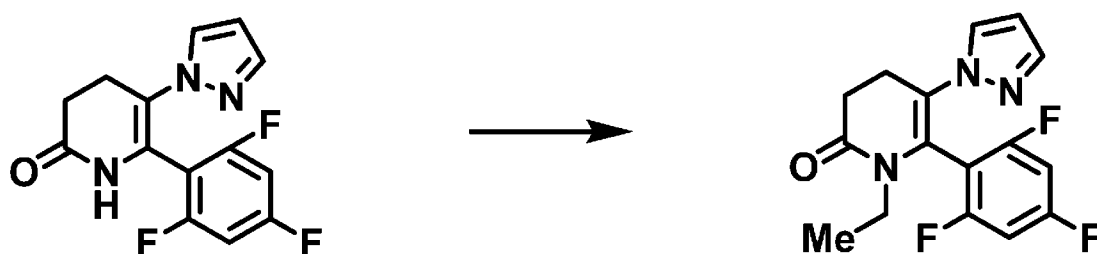
[1115] 参考例24で得られた5-オキソ-4-(1H-ピラゾール-1-イル)-5-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ペンタン酸 3.66 g に、酢酸アンモニウム 9.03 g と酢酸 36.6 ml を加えて、120℃で1.5時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が1.10 g の褐色固体として得られた。

[1116] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.53 (1H, dd, $J = 1.8, 0.6$ Hz), 7.10 (1H, d, $J = 2.4$ Hz), 6.72-6.65 (2H, m), 6.71 (1H, br s), 6.16 (1H, dd, $J = 2.4, 1$

. 8 Hz), 3.10–3.09 (2H, m), 2.86–2.84 (2H, m).

[1117] ステップ2：1-エチル-5-(1H-ピラゾール-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号：25)

[化201]

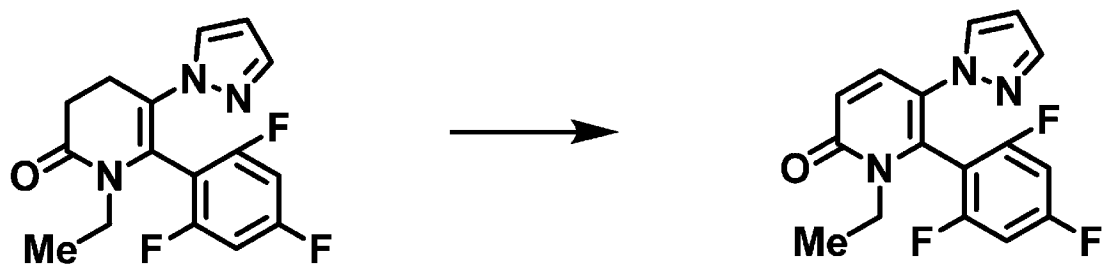


[1118] 5-(1H-ピラゾール-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オン 448 mg、ヨウ化エチル 244 μ l と炭酸セシウム 996 mg を含む DMF 4.5 ml を 50℃ で 30 分間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液と飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 430 mg の茶色固体として得られた。

[1119] [合成例 16]

1-エチル-5-(1H-ピラゾール-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号：26)

[化202]

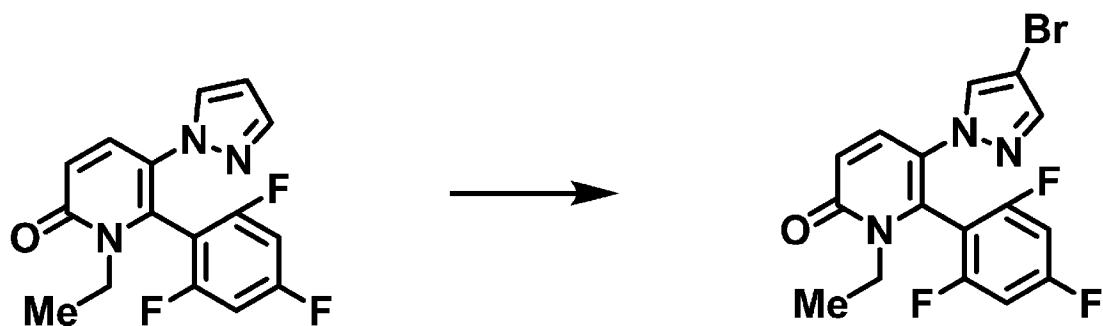


[1120] 1-エチル-5-(1H-ピラゾール-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オン 430 mg、2,3-ジクロロ-5,6-ジシアノ-p-ベンゾキノ 1.22 g を含むトルエン溶液 8 ml を加熱還流下で4時間攪拌した。室温まで冷却した後に、減圧下で溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が315 mgの茶色固体として得られた。

[1121] [合成例17]

ステップ1：5-(4-ブロモ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成

[化203]



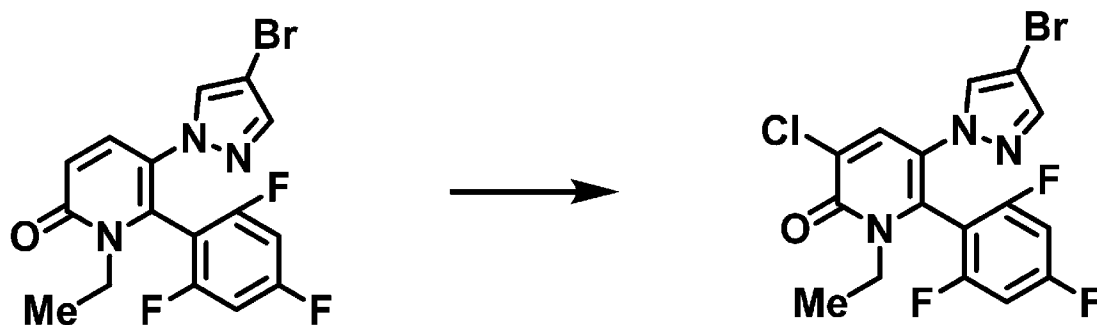
[1122] 1-エチル-5-(1H-ピラゾール-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 136 mg、N-ブロモスクシンイミド 83 mg を含むDMF溶液 3 ml を60℃で15分間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物にチオ硫酸ナトリウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、

硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が153mgの白色固体として得られた。

[1123] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.41 (1H, d, $J = 9.5$ Hz), 7.40 (1H, d, $J = 0.7$ Hz), 7.34 (1H, s), 6.76–6.71 (2H, m), 6.75 (1H, d, $J = 9.5$ Hz), 3.88 (2H, q, $J = 7.1$ Hz), 1.17 (3H, t, $J = 7.1$ Hz).

[1124] ステップ2: 5-(4-ブロモ-1H-ピラゾール-1-イル)-3-クロロ-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号: 70)

[化204]

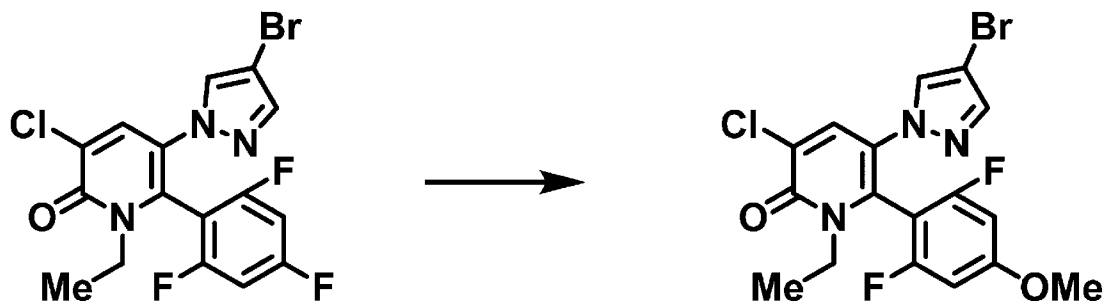


[1125] 5-(4-ブロモ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 153mg、N-クロロスクシンイミド 56mgを含むDMF溶液 3mlを80℃で3時間攪拌した。さらに反応混合物にN-クロロスクシンイミド 56mgを加えて、80℃で55分間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物にチオ硫酸ナトリウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が154mgの白色固体として得られた。

[1126] [合成例 18]

5-(4-ブromo-1H-ピラゾール-1-イル)-3-クロロ-6-(2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル)-1-エチルピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号: 72)

[化205]

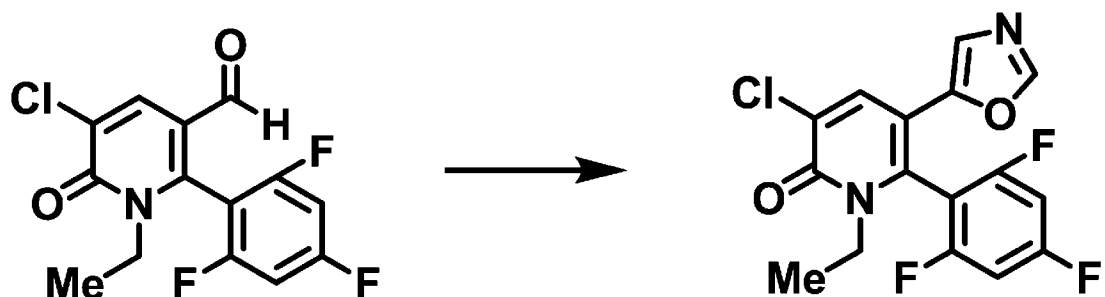


[1127] 5-(4-ブromo-1H-ピラゾール-1-イル)-3-クロロ-1-エチル-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 51 mg、5 Mナトリウムメトキシドのメタノール溶液 118 μ lを含むメタノール溶液 3 mlを60℃で1時間攪拌した。室温まで冷却した後に、塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が44 mgの白色固体として得られた。

[1128] [合成例 19]

3-クロロ-1-エチル-5-(オキサゾール-5-イル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号: 36)

[化206]

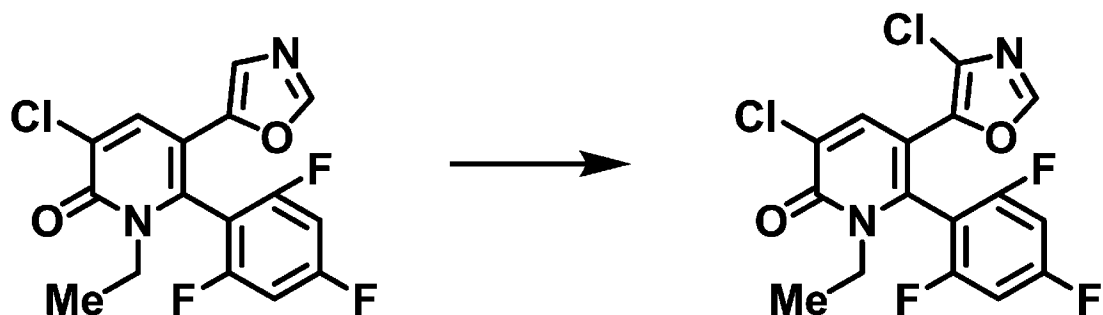


[1129] 5-クロロ-1-エチル-6-オキソ-2-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-1, 6-ジヒドロピリジン-3-カルボアルデヒド 2.00 g、p-トルエンスルホニルメチルイソシアニド 1.36 g、炭酸カリウム 1.76 gを含むメタノール溶液 20 mlを室温で2時間攪拌した。次いで、この反応混合物を50℃で30分間攪拌した。室温まで冷却した後、反応混合物に水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が1.50 gの白色固体として得られた。

[1130] [合成例20]

3-クロロ-5-(4-クロロオキサゾール-5-イル)-1-エチル-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号: 112)

[化207]



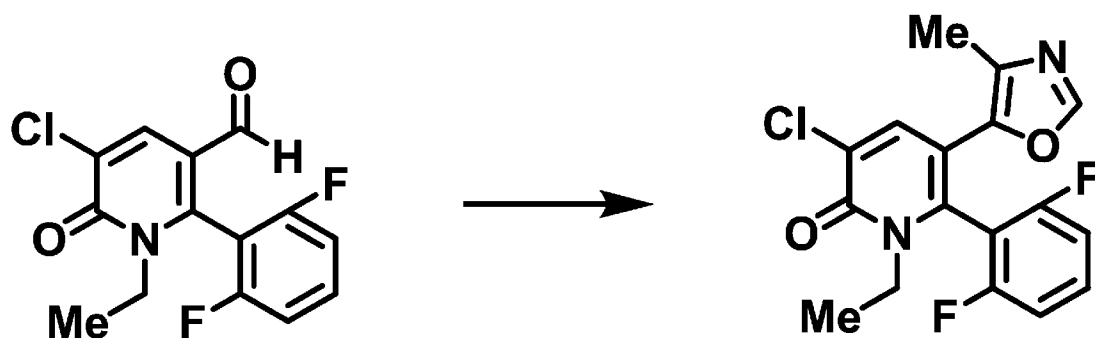
[1131] 3-クロロ-1-エチル-5-(オキサゾール-5-イル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 100 mgを含むDMF溶液 2 mlに、1.3 mol/LのヘキサメチルジシラザンリチウムのTHF溶液 0.23 mlを-60℃で滴下して1時間攪拌した。次いで、反応混合物にN-クロロスクシンイミド 38 mgを加えた後に、室温で3時間攪拌した。反応混合物にチオ硫酸ナトリウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を1規定塩酸と飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が62 mg

の淡黄色固体として得られた。

[1132] [合成例 2 1]

3-クロロ-6-(2, 6-ジフルオロフェニル)-1-エチル-5-(4-メチルオキサゾール-5-イル)ピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号: 43)

[化208]

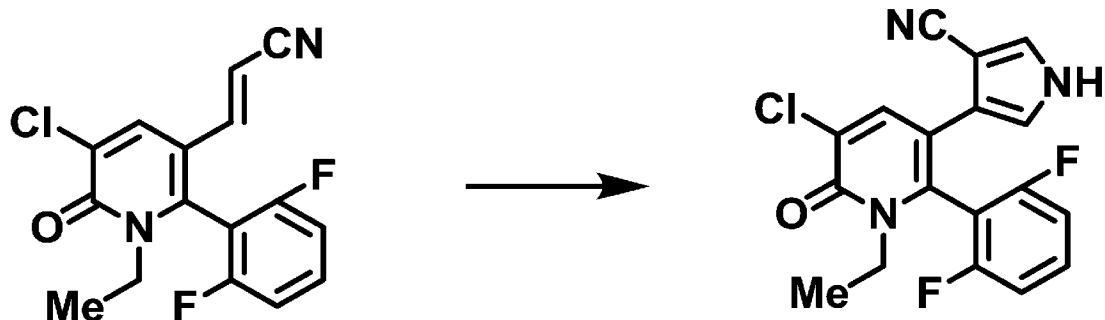


[1133] 5-クロロ-2-(2, 6-ジフルオロフェニル)-1-エチル-6-オキソ-1, 6-ジヒドロピリジン-3-カルボアルデヒド 100 mg、1-((1-イソシアノエチル)スルホニル)-4-メチルベンゼン 77 mg、炭酸カリウム 93 mgを含むメタノール溶液 3 mlを加熱還流下で5.5時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が55 mgの橙色固体として得られた。

[1134] [合成例 2 2]

4-(5-クロロ-1-エチル-6-オキソ-2-(2, 6-ジフルオロフェニル)-1, 6-ジヒドロピリジン-3-イル)-1H-ピロール-3-カルボニトリルの合成(化合物番号: 88)

[化209]

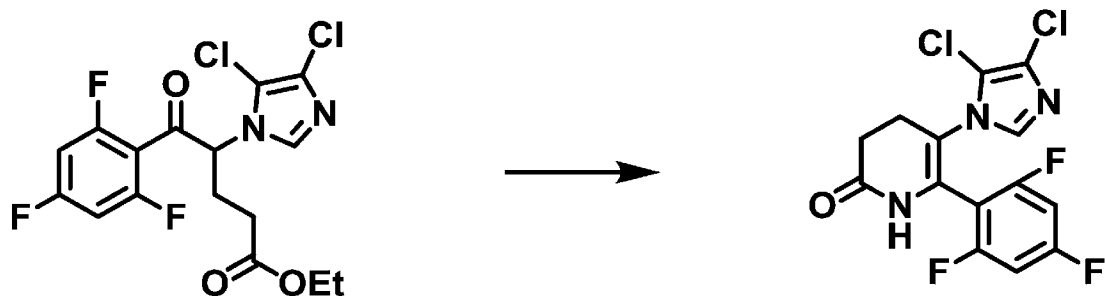


[1135] 参考例 3 1 で得られた (E) - 3 - (5 - クロロ - 1 - エチル - 6 - オキソ - 2 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - イル) アクリロニトリル 150 mg、p - トルエンスルホニルメチルイソシアニド 109 mg、60%水素化ナトリウム 26 mg を含むジエチルエーテル 3 ml とジメチルスルホキシド 1 ml の溶液を室温下で 2.5 時間攪拌した。反応混合物に水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 88 mg の茶色固体として得られた。

[1136] [合成例 2 3]

ステップ 1 : 5 - (4, 5 - ジクロロ - 1 H - イミダゾール - 1 - イル) - 6 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - 3, 4 - ジヒドロピリジン - 2 (1 H) - オンの合成

[化210]



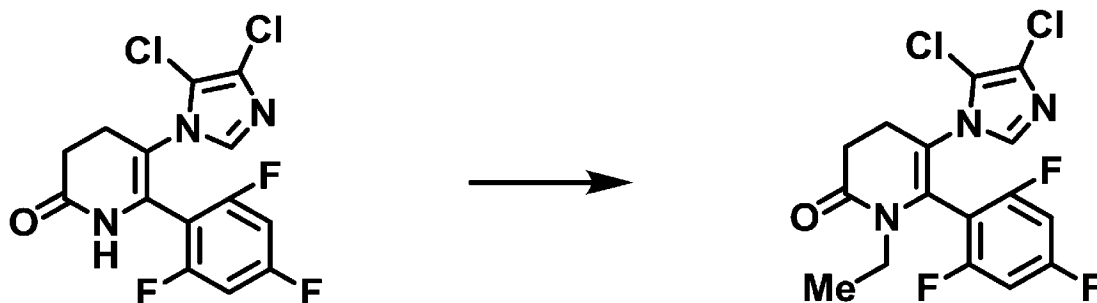
[1137] 参考例 3 3 で得られた 4 - (4, 5 - ジクロロ - 1 H - イミダゾール - 1 - イル) - 5 - オキソ - 5 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) ペンタ

ン酸エチル 2.61 g に、酢酸アンモニウム 9.77 g と酢酸 25.0 ml を加えて、120℃で7時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が1.05 g の褐色固体として得られた。

[1138] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.17 (1H, s), 6.78 (1H, s), 6.71–6.69 (2H, m), 2.87–2.85 (4H, m).

[1139] ステップ2: 5-(4,5-ジクロロ-1H-イミダゾール-1-イル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オンの合成

[化211]



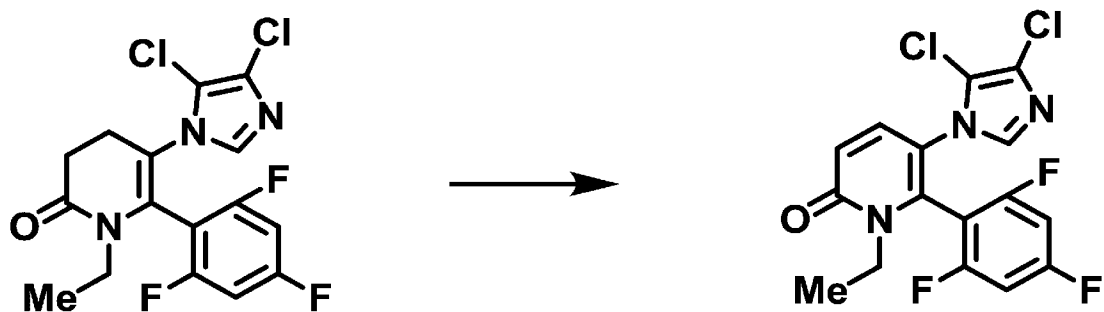
[1140] 5-(4,5-ジクロロ-1H-イミダゾール-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オン 419 mg、ヨウ化エチル 139 μl と炭酸セシウム 565 mg を含むDMF 4.2 ml を50℃で40分間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液と飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が388 mg の褐色固体として得られた。

[1141] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.17 (1H, s), 6.7

1-6.69 (2H, m), 3.41 (2H, s), 2.83-2.74 (4H, m), 0.99 (3H, t, J = 7.1 Hz).

[1142] ステップ3: 5-(4,5-ジクロロ-1H-イミダゾール-1-イル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号: 136)

[化212]

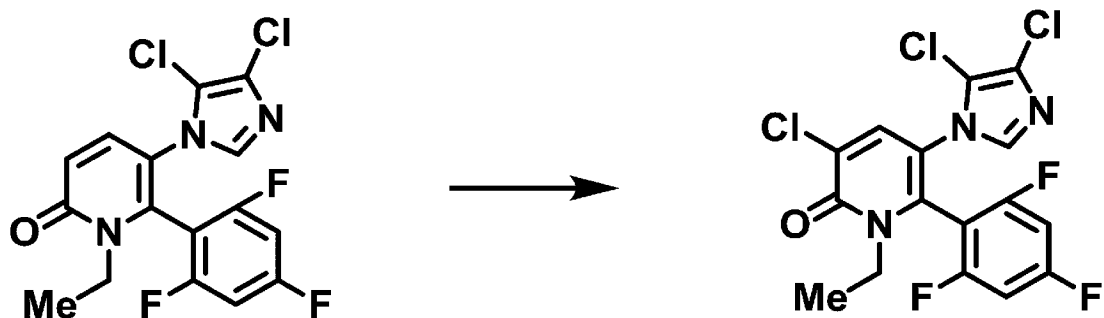


[1143] 5-(4,5-ジクロロ-1H-イミダゾール-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オン 388 mgを含む四塩化炭素溶液 7.8 mlに、N-ブロモスクシンイミド 194 mgとアゾビスイソブチロニトリル 16 mgを加えて、90℃で30分間攪拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液と飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が284 mgの褐色固体として得られた。

[1144] [合成例24]

3-クロロ-5-(4,5-ジクロロ-1H-イミダゾール-1-イル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号: 138)

[化213]

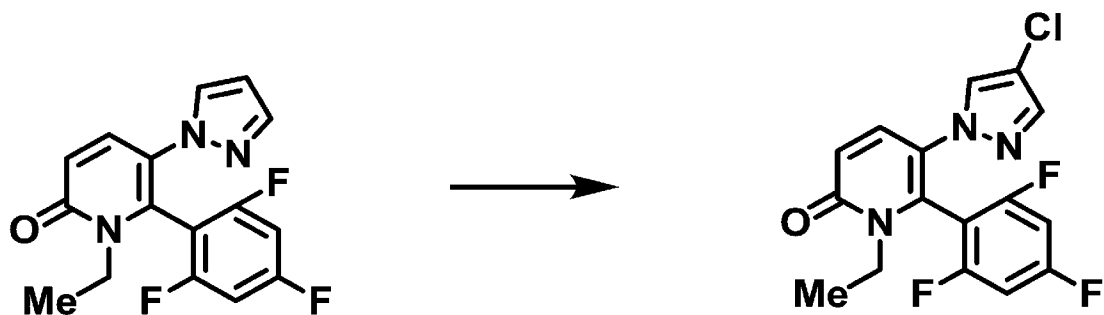


- [1145] 5-(4,5-ジクロロ-1H-イミダゾール-1-イル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 122 mg、N-クロロスクシンイミド 55 mg を含む DMF 溶液 3 ml を 80℃ で 1 時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液と飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 79 mg の白色固体として得られた。

[合成例 25]

5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成 (化合物番号: 27)

[化214]



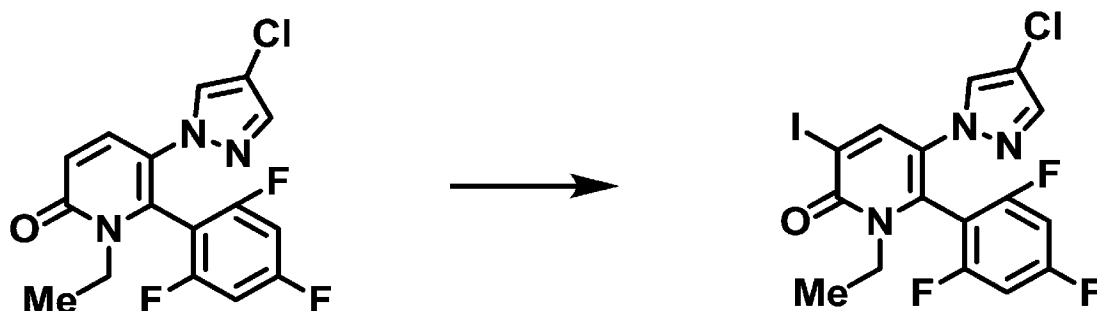
- [1146] 1-エチル-5-(1H-ピラゾール-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 176 mg、N-クロロスクシンイミド 82.3 mg を含む DMF 溶液 3 ml を 70℃ で 5

0分間撹拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物にチオ硫酸ナトリウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が163mgの白色固体として得られた。

[1147] [合成例26]

5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-3-ヨード-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号:140)

[化215]



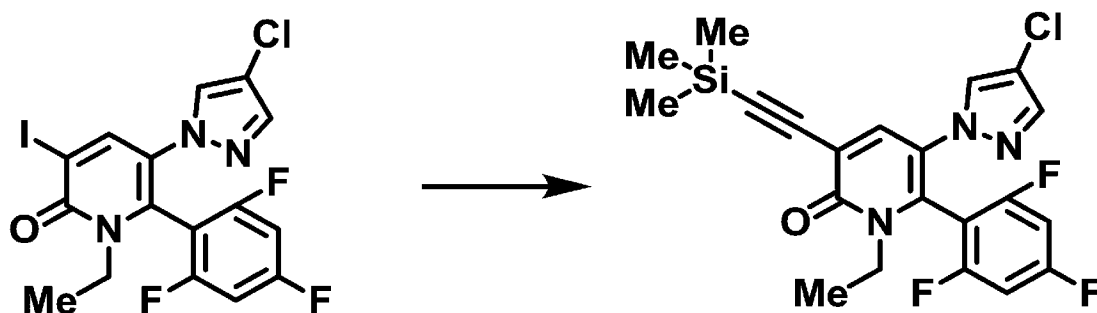
[1148] 5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 750mg、N-ヨードスクシンイミド 954mg、硫酸 113 μ lを含むメタノール溶液 14mlを60℃で5時間撹拌した。次いで、N-ヨードスクシンイミド 954mg、硫酸 113 μ lをこの溶液に加えて、60℃で2時間撹拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物にチオ硫酸ナトリウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が954mgの淡黄色固体として得られた。

[1149] [合成例27]

ステップ1: 5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-3-((トリメチルシ

リル) エチニル) ピリジン-2 (1H) -オンの合成

[化216]

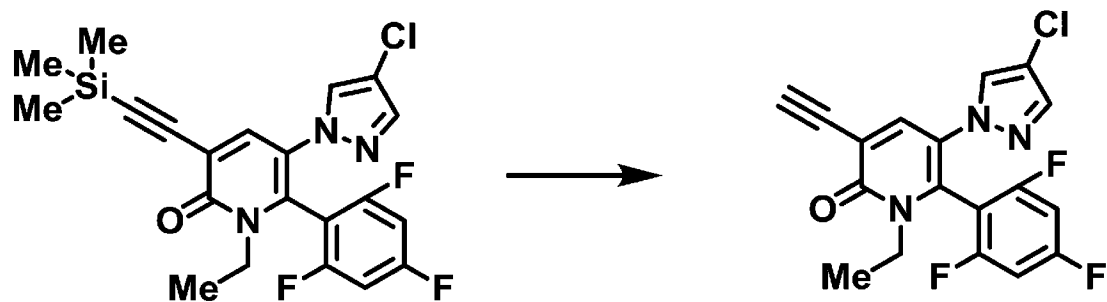


[1150] 合成例26で得られた5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-3-ヨード-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 300mg、トリメチルシリルアセチレン 865 μ l、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II) 44mg、ヨウ化銅 12mgを含むDMF溶液1mlにトリエチルアミン 3mlを加えて室温で1時間撹拌した。反応混合物に1規定塩酸と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が258mgの黄色固体として得られた。

[1151] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.64 (1H, s), 7.35 (1H, s), 7.32 (1H, s), 6.75-6.71 (2H, m), 3.89 (2H, q, $J = 7.1 \text{ Hz}$), 1.18 (3H, t, $J = 7.1 \text{ Hz}$), 0.26 (9H, s).

[1152] ステップ2: 5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-3-エチニル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号: 223)

[化217]

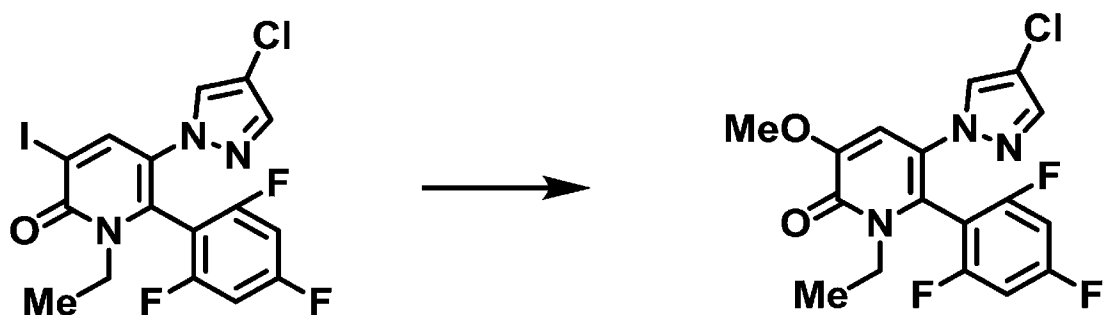


- [1153] 5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-3-((トリメチルシリル)エチニル)ピリジン-2(1H)-オン 255 mg、炭酸カリウム 391 mg を含むメタノール溶液 5 ml を室温で 15 分間攪拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 161 mg の黄色固体として得られた。

[1154] [合成例 28]

5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-3-メトキシ-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成 (化合物番号: 225)

[化218]



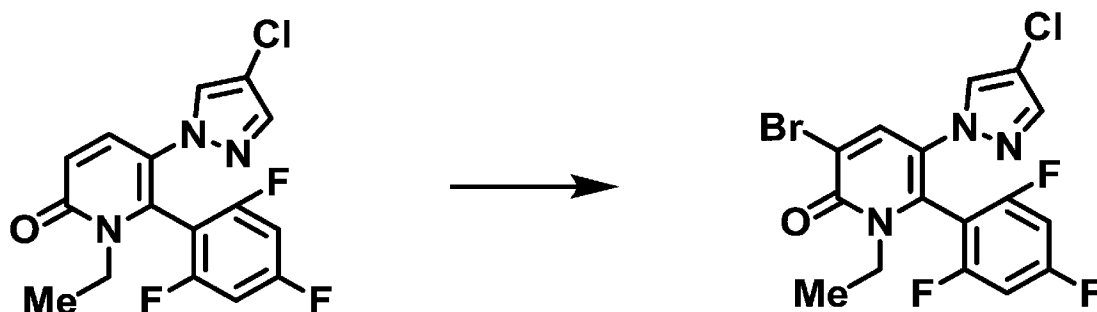
- [1155] 合成例 26 で得られた 5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-3-ヨード-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 143 mg、酢酸パラジウム (II) 6.7

mg、2-ジ-tert-ブチルホスフィノ-2,4,6-トリイソプロピルビフェニル 32 mg、炭酸セシウム 147 mg、メタノール 1 ml を含むトルエン溶液 3 ml を 60℃ で 4 時間攪拌した。反応混合物に 1 規定塩酸と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 33 mg の白色固体として得られた。

[1156] [合成例 29]

5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-3-ブロモ-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号: 71)

[化219]



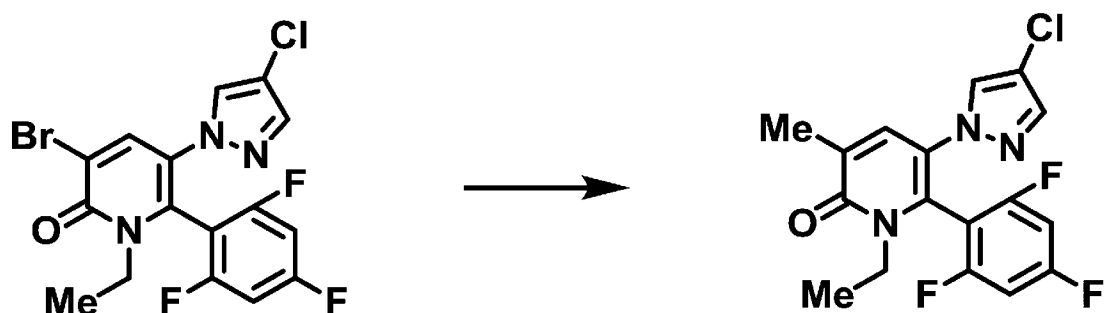
[1157] 5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 730 mg、N-ブロモスクシンイミド 551 mg を含む DMF 溶液 7 ml を 80℃ で 1 時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物にチオ硫酸ナトリウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 836 mg の白色固体として得られた。

[1158] [合成例 30]

5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-3-メチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-

オンの合成（化合物番号：206）

[化220]

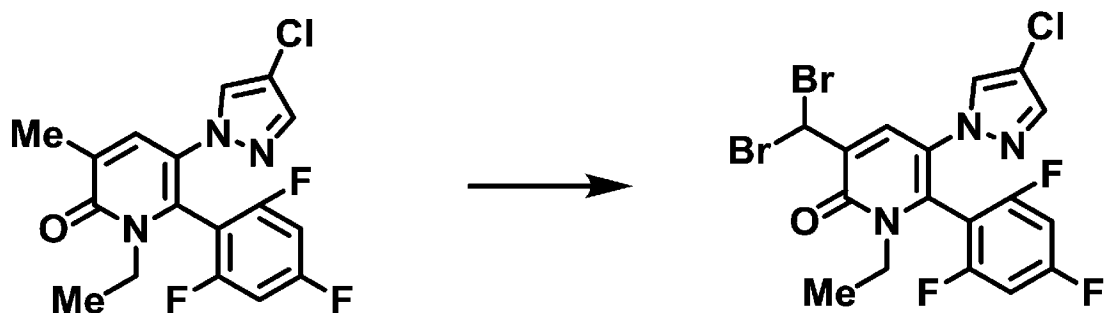


5-（4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル）-1-エチル-3-ブ
ロモ-6-（2,4,6-トリフルオロフェニル）ピリジン-2（1H）-
オン 836mg、メチルボロン酸463mg、酢酸パラジウム（II）4
3mg、リン酸三カリウム1.44gとトリシクロヘキシルホスフィン 1
08mgを含むトルエン 6.8mlと水 1.7mlの混合溶液を、加熱
還流下で20分間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に水と酢酸
エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した後に、硫
酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリ
カゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が559mg
の褐色固体として得られた。

[1159] [合成例31]

ステップ1：5-（4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル）-3-（
ジブロモメチル）-1-エチル-6-（2,4,6-トリフルオロフェニル
）ピリジン-2（1H）-オンの合成

[化221]

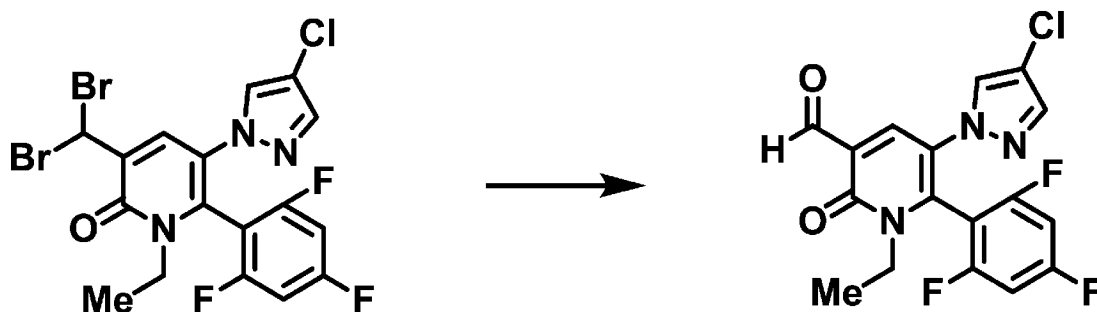


[1160] 5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-3-メチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 559 mgを含むクロロベンゼン溶液 11.2 mlに、N-ブロモスクシンイミド 568 mgとアゾビスイソブチロニトリル 25 mgを加えて、110℃で20分間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液と飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。次いで、減圧下で溶媒留去した後に、表題の化合物を含む829 mgの黄色油状物を得た。

[1161] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.05 (1H, s), 7.39 (1H, s), 7.38 (1H, s), 6.96 (1H, s), 6.77-6.75 (2H, m), 3.93 (2H, q, $J = 7.1 \text{ Hz}$), 1.19 (3H, t, $J = 7.1 \text{ Hz}$).

[1162] ステップ2: 5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-2-オキソ-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボアルデヒドの合成 (化合物番号: 265)

[化222]



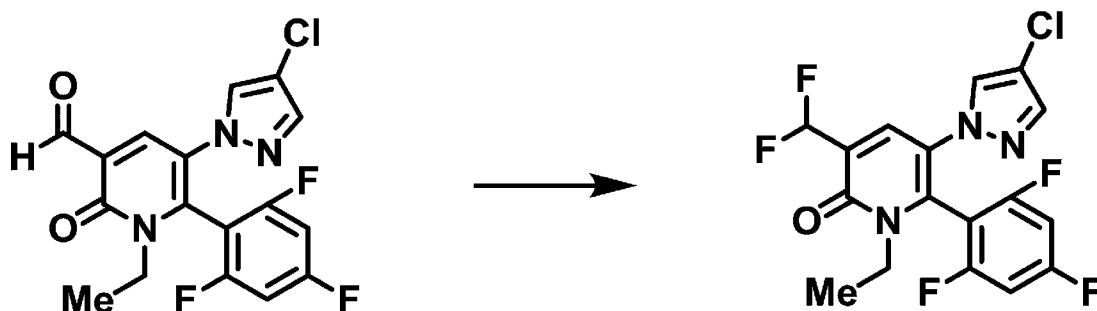
[1163] 合成例30のステップ1で得られた5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-3-(ジブロモメチル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 829 mgを含むアセトニトリル溶液 8 mlに、硝酸銀 536 mgを含む水溶液 4 mlを加え

て、室温下で 10 分間攪拌した。反応混合物をセライト濾過し、酢酸エチルで洗浄した。得られた有機層を水、1 規定塩酸、および飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 505 mg の白色固体として得られた。

[1164] [合成例 32]

5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-3-(ジフルオロメチル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号: 266)

[化223]

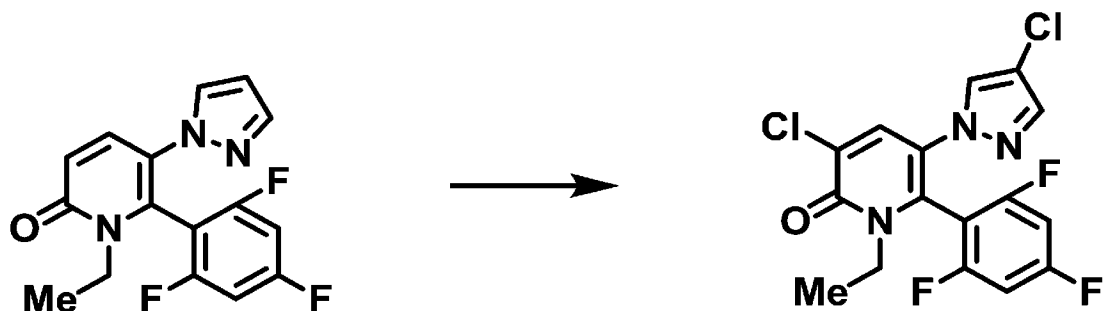


5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-2-オキソ-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボアルデヒド 208 mg、(ジエチルアミノ)サルファートリフルオリド 286 μ l を含むジクロロメタン溶液 3 ml を、室温下で 30 分間攪拌した。次いで、反応混合物に 1 規定塩酸と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した後に、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 169 mg の白色固体として得られた。

[1165] [合成例 33]

3-クロロ-5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号: 40)

[化224]

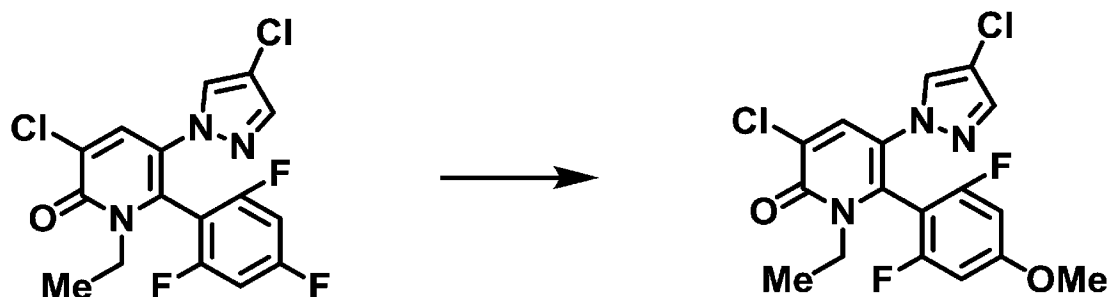


- [1166] 1-エチル-5-(1H-ピラゾール-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 1.19 g、N-クロロスクシンイミド 1.49 gを含むDMF溶液 12 mlを80℃で40分間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物にチオ硫酸ナトリウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が1.13 gの白色固体として得られた。

[1167] [合成例34]

3-クロロ-5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-6-(2,6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル)-1-エチルピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号: 41)

[化225]



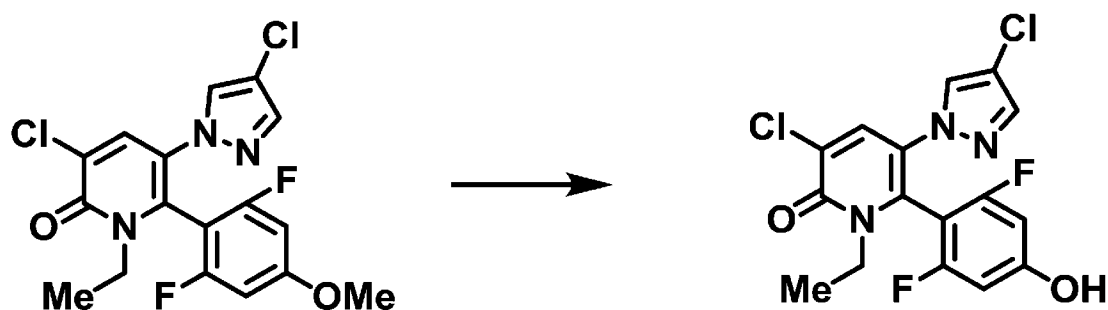
- [1168] 3-クロロ-5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 578 mg、ナトリウムメトキシド 402 mgを含むメタノール溶

液 6 m l を 6 0 ° C で 5 時間攪拌した。次いで、ナトリウムメトキシド 4 0 2 m g を加えて、さらに 6 0 ° C で 2 時間攪拌した。室温まで冷却した後に、塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 5 2 0 m g の白色固体として得られた。

[1169] [合成例 3 5]

3-クロロ-5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-6-(2,6-ジフルオロ-4-ヒドロキシフェニル)-1-エチルピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号: 184)

[化226]

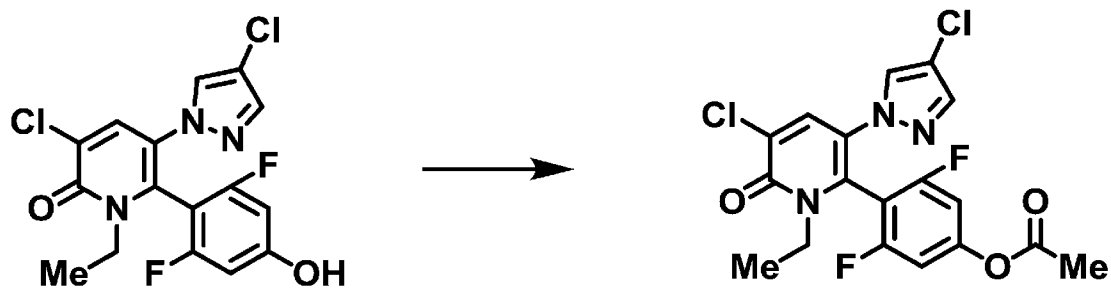


[1170] 3-クロロ-5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-6-(2,6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル)-1-エチルピリジン-2(1H)-オン 27 m g、臭化水素酸 2 m l を含む酢酸溶液 2 m l を 1 1 0 ° C で 7 時間攪拌した。室温まで冷却した後に、炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて中和した。酢酸エチルを加えて分液し、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 2 2 m g の白色固体として得られた。

[1171] [合成例 3 6]

4-(5-クロロ-3-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-6-オキソ-1,6-ジヒドロピリジン-2-イル)-3,5-ジフルオロフェニル酢酸の合成(化合物番号: 205)

[化227]

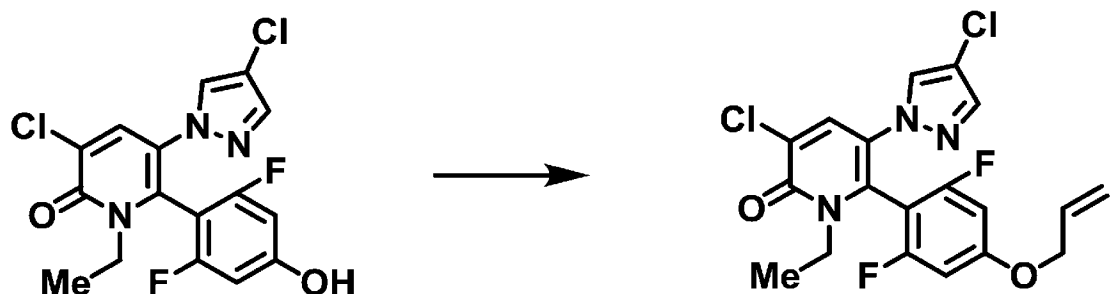


[1172] 3-クロロ-5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-6-(2,6-ジフルオロ-4-ヒドロキシフェニル)-1-エチルピリジン-2(1H)-オン 80 mg、無水酢酸 98 μ l、ピリジン 33 μ lを含むジクロロエタン溶液 2 ml を室温で3時間攪拌した。反応混合物に、1規定塩酸とジクロロメタンを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が70 mgの橙白色固体として得られた。

[1173] [合成例37]

6-(4-(アリルオキシ)-2,6-ジフルオロフェニル)-3-クロロ-5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチルピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号:202)

[化228]



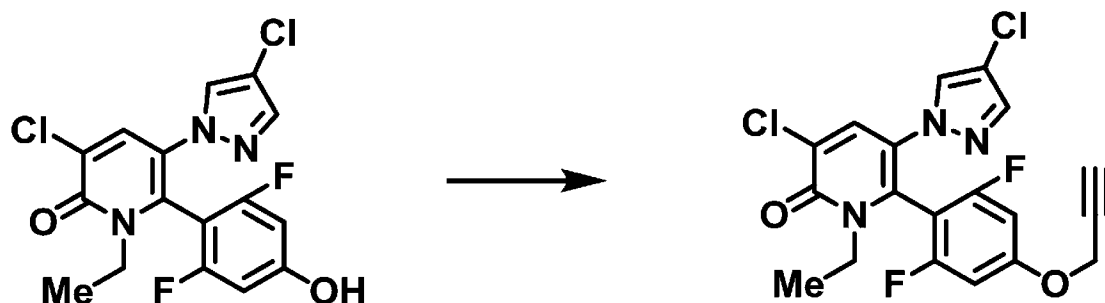
[1174] 3-クロロ-5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-6-(2,6-ジフルオロ-4-ヒドロキシフェニル)-1-エチルピリジン-2(1H)-オン 70 mg、臭化アリル 23 μ l、炭酸セシウム 89 mgを含むアセトニトリル溶液 2 ml を室温で3時間攪拌した。次いで、臭化

アリル 31 μ l を加えて、室温で1時間攪拌した。この反応混合物に、塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が49 mg の黄白色固体として得られた。

[1175] [合成例38]

3-クロロ-5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-6-(2,6-ジフルオロ-4-(プロパルギルオキシ)フェニル)-1-エチルピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号:201)

[化229]

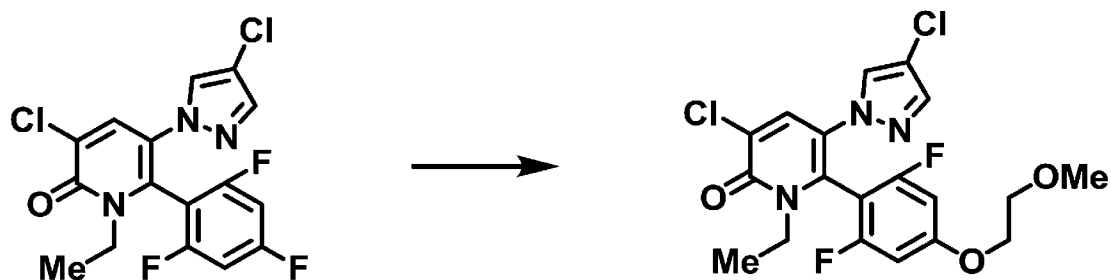


[1176] 3-クロロ-5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-6-(2,6-ジフルオロ-4-ヒドロキシフェニル)-1-エチルピリジン-2(1H)-オン 70 mg、臭化プロパルギル 20 μ l、炭酸セシウム 85 mg を含むアセトニトリル溶液 2 ml を室温で3時間攪拌した。次いで、臭化プロパルギル 27 μ l を加えて、室温で1時間攪拌した。この反応混合物に、塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が64 mg の黄白色固体として得られた。

[1177] [合成例39]

3-クロロ-5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-6-(2,6-ジフルオロ-4-(2-メトキシエトキシ)フェニル)-1-エチルピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号:204)

[化230]

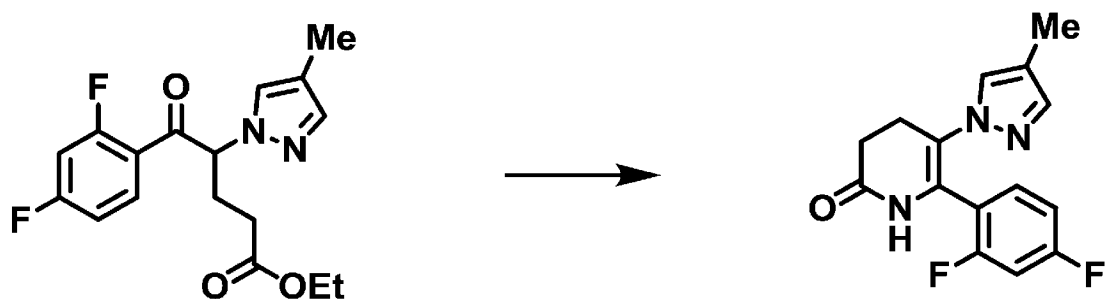


[1178] 3-クロロ-5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 75 mg、60%水素化ナトリウム 23 mg、2-メトキシエタノール 46 μ lを含むTHF溶液4 mlを室温で2時間攪拌した。この反応混合物に、塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が65 mgの白色固体として得られた。

[1179] [合成例40]

ステップ1：6-(2,4-ジフルオロフェニル)-5-(4-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オンの合成

[化231]



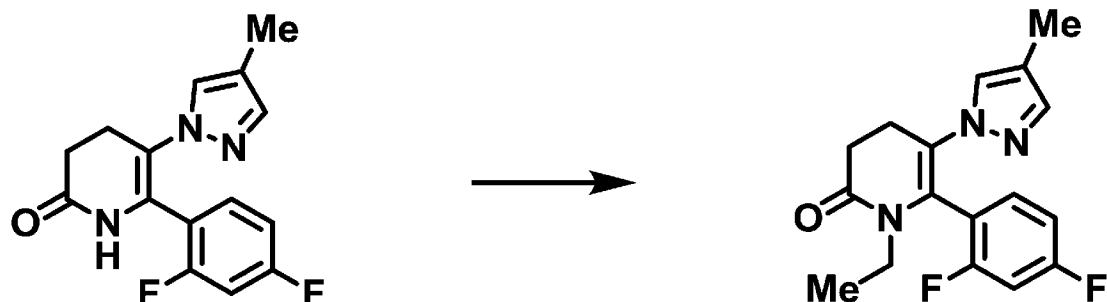
[1180] 参考例35で得られた5-(2,4-ジフルオロフェニル)-4-(4-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)-5-オキソペンタン酸エチル 4.79 gに、酢酸アンモニウム 21.8 gと酢酸 24.0 mlを加えて、120℃で1.5時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に炭

酸カリウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が2.42 gの褐色固体として得られた。

[1181] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.35 (1H, s), 7.06–7.00 (1H, m), 6.87–6.78 (2H, m), 6.75 (1H, s), 6.71 (1H, s), 3.03–3.01 (2H, m), 2.83–2.79 (2H, m), 1.93 (3H, s).

ステップ2: 6-(2,4-ジフルオロフェニル)-1-エチル-5-(4-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オンの合成

[化232]

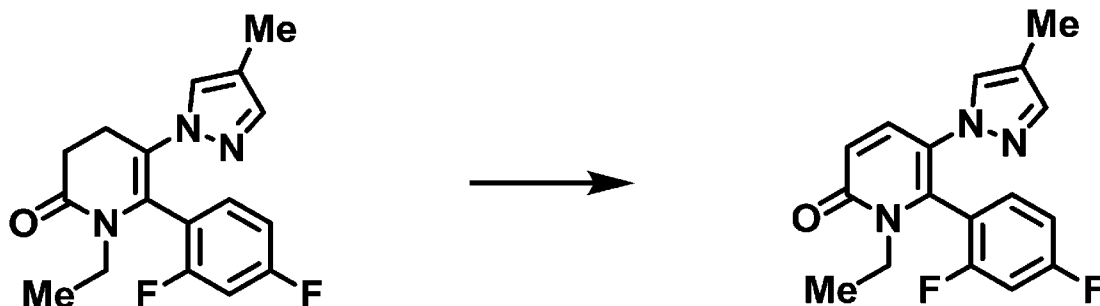


[1182] 6-(2,4-ジフルオロフェニル)-5-(4-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オン 513 mg、ヨウ化エチル 211 μl と炭酸セシウム 859 mgを含むDMF 5 mlを50℃で1.5時間攪拌した。さらに、ヨウ化エチル 70.3 μl と炭酸セシウム 286 mgを加えて、50℃で30分間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液と飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が463 mgの褐色固体として得られた。

[1183] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.28–7.25 (1H, m), 7.13–7.07 (1H, m), 6.87–6.79 (2H, m), 6.74 (1H, s), 3.62–3.55 (1H, m), 3.22–3.18 (1H, m), 3.01–2.94 (1H, m), 2.83–2.72 (3H, m), 1.90 (3H, s), 0.94 (3H, t, $J = 7.1 \text{ Hz}$).

[1184] ステップ3: 6-(2,4-ジフルオロフェニル)-1-エチル-5-(4-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)ピリジン-2(1H)-オンの合成(化合物番号: 505)

[化233]



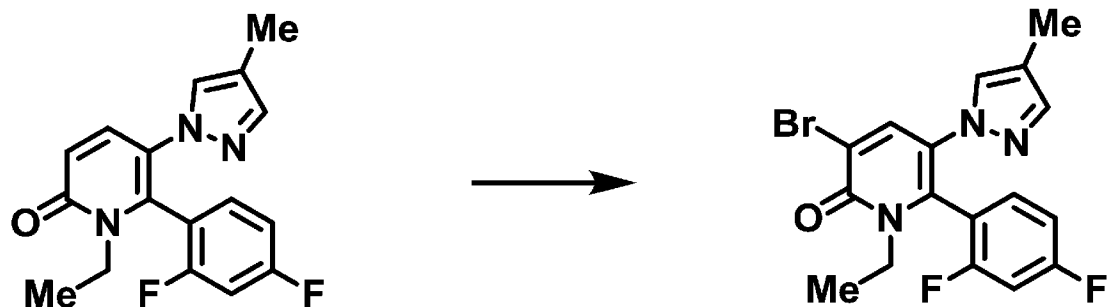
[1185] 6-(2,4-ジフルオロフェニル)-1-エチル-5-(4-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オン 463 mgを含む四塩化炭素溶液 9.0 mlに、N-ブロモスクシンイミド 312 mgと2,2'-アゾビス(4-メトキシ-2,4-ジメチルバレロニトリル) 68 mgを加えて、40℃で1.5時間攪拌した。反応混合物に水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液と飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が249 mgの白色固体として得られた。

[1186] [合成例41]

3-ブromo-6-(2,4-ジフルオロフェニル)-1-エチル-5-(4-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)ピリジン-2(1H)-オンの

合成（化合物番号：226）

[化234]

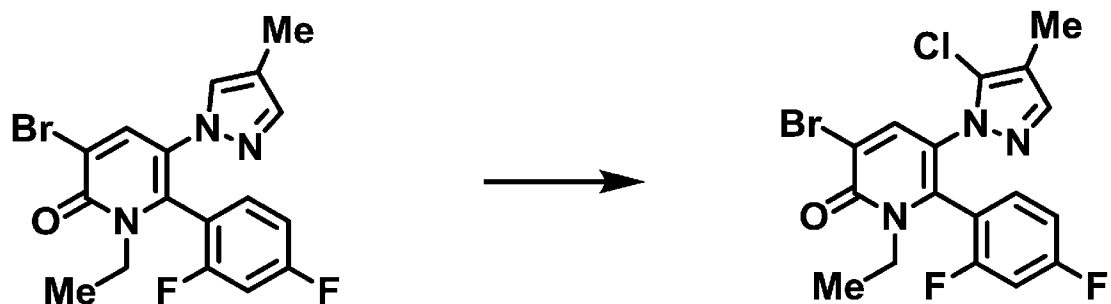


[1187] 6-(2,4-ジフルオロフェニル)-1-エチル-5-(4-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)ピリジン-2(1H)-オン 249 mg、N-ブロモスクシンイミド 169 mgを含むアセトニトリル溶液 4 mlを50℃で10分間撹拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物にチオ硫酸ナトリウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が230 mgの白色固体として得られた。

[1188] [合成例42]

3-ブromo-5-(5-クロロ-4-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)-6-(2,4-ジフルオロフェニル)-1-エチルピリジン-2(1H)-オンの合成（化合物番号：228）

[化235]



[0000]

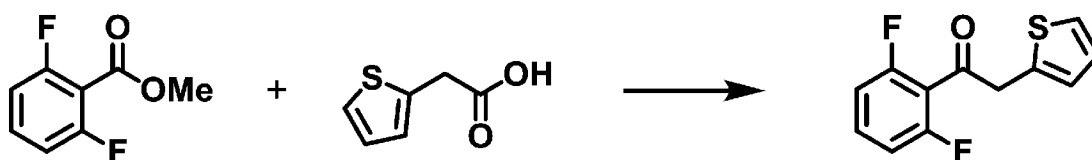
3-ブromo-6-(2,4-ジフルオロフェニル)-1-エチル-5-(

4-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)ピリジン-2(1H)-オン 184 mg、N-クロロスクシンイミド 81 mgを含むアセトニトリル溶液 3 mlを80℃で30分間攪拌した。さらに、N-クロロスクシンイミド 19 mgを50℃で加えて、80℃で10分間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液と飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が64 mgの白色固体として得られた。

[1189] [参考例1]

1-(2,6-ジフルオロフェニル)-2-(チオフエン-2-イル)エタン-1-オンの合成

[化236]



[1190] 2-(チオフエン-2-イル)酢酸 10.00 gを含むTHF溶液 100 mlに、1.9 mol/LのヘキサメチルジシラザンナトリウムのTHF溶液 118.5 mlを-78℃で滴下して1時間攪拌した。次いで、2,6-ジフルオロ安息香酸メチル 12.11 gを含むTHF溶液20 mlを滴下した後に、-78℃から室温まで昇温して2.5時間攪拌した。これに飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて1時間攪拌した後に、酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が10.35 gの赤色油状物として得られた。

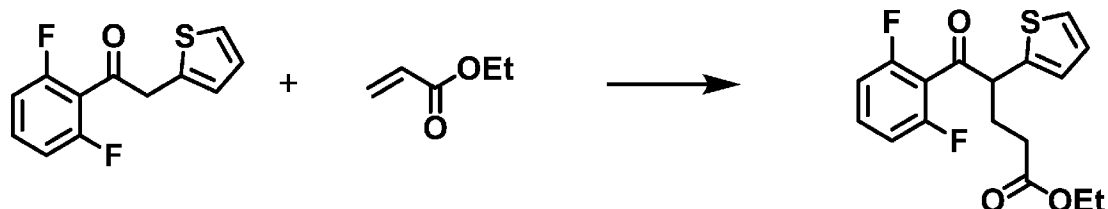
[1191] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.39 (1H, m), 7.22 (1H, m), 6.95 (4H, m), 4.36 (1H,

s) .

[1192] [参考例 2]

5 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 5 - オキソ - 4 - (チオフェン - 2 - イル) ペンタン酸エチルの合成

[化237]

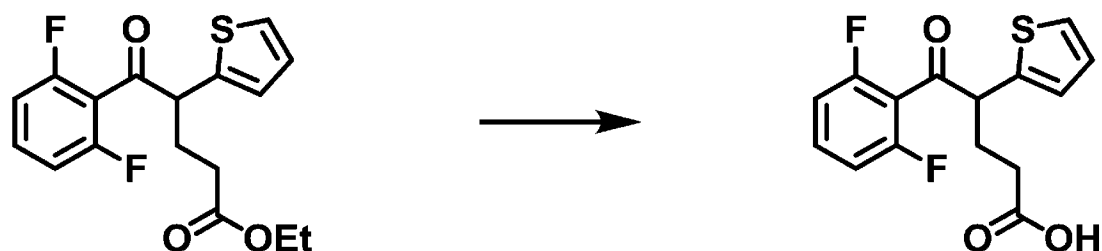


[1193] 参考例 1 で得られた 1 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 2 - (チオフェン - 2 - イル) エタン - 1 - オン 10.35 g を含む THF 溶液 104 ml に、カリウム t - ブトキシド 730 mg とアクリル酸エチル 5.20 ml を加えて、 -3°C で 23 時間攪拌した。これに 1 規定塩酸と酢酸エチルを加えて分液した後に、得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去した後に、表題の化合物を含む 12.79 g の赤色油状物を得た。これ以上精製することなく、次の反応に使用した。

[1194] [参考例 3]

5 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 5 - オキソ - 4 - (チオフェン - 2 - イル) ペンタン酸の合成

[化238]



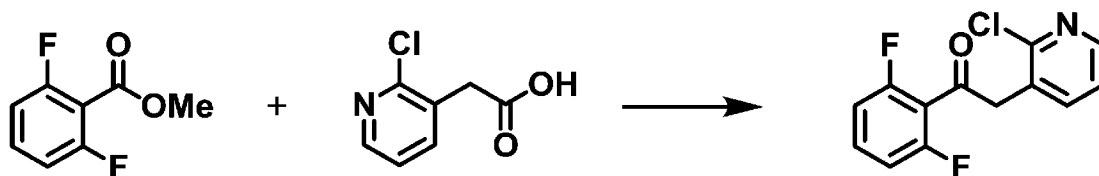
[1195] 参考例 2 で得られた 5 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 5 - オキソ - 4 - (チオフェン - 2 - イル) ペンタン酸エチル 3.37 g を含む THF

102 ml と水 26 ml との混合溶液に、水酸化リチウム 1 水和物 7.93 g を加えて、50℃で2.5時間攪拌した。室温まで冷却した後に、液量が半分程度になるまで反応混合物の溶媒を留去した。これに水とジエチルエーテルを加えて分液し、得られた水層に濃塩酸と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。次いで、減圧下にて溶媒留去した後に、表題の化合物を含む8.64 g の淡黄色油状物を得た。これ以上精製することなく、次の反応に使用した。

[1196] [参考例 4]

2-(2-クロロピリジン-3-イル)-1-(2,6-ジフルオロフェニル)エタン-1-オンの合成

[化239]



[1197] 2-(2-クロロピリジン-3-イル)酢酸 700 mg を含む THF 溶液 30 ml に、1.9 mol/L のヘキサメチルジシラザンナトリウムの THF 溶液 7.75 ml を -78℃で滴下して10分間攪拌した。次いで、2,6-ジフルオロ安息香酸メチル 616 μl を滴下した後に、-78℃から室温まで昇温して1時間攪拌した。これに飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて1時間攪拌した後に、酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が450 mg の透明油状物として得られた。

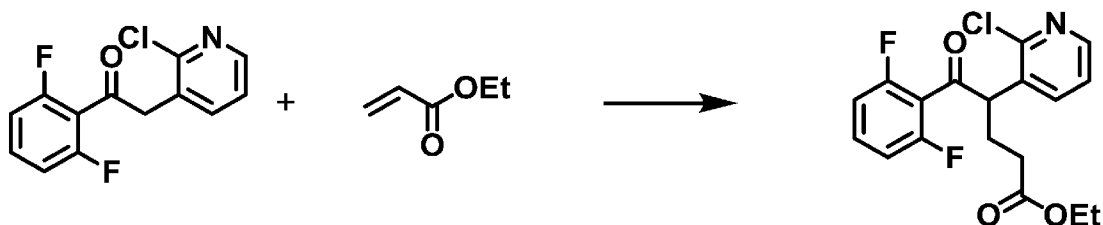
[1198] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.35 (1H, dd, $J = 4.7, 1.8$ Hz), 7.66 (1H, dd, $J = 7.6, 1.8$ Hz), 7.44-7.43 (1H, m), 7.25 (2H, dd, $J = 7.6, 4.7$ Hz), 7.0

0-6.96 (2H, m).

[1199] [参考例5]

4-(2-クロロピリジン-3-イル)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-5-オキソペンタン酸エチルの合成

[化240]

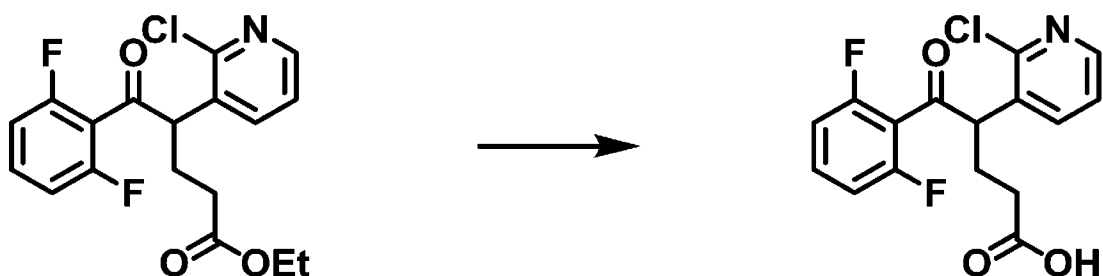


[1200] 2-(2-クロロピリジン-3-イル)-1-(2,6-ジフルオロフェニル)エタン-1-オン 450mgを含むTHF溶液 10mlに、カリウム t-ブトキシド 84mgとアクリル酸エチル 192 μ lを加えて、室温で2.5時間攪拌した。さらに、カリウム t-ブトキシド 28mgとアクリル酸エチル 154 μ lを加えて、60℃で7時間攪拌した。室温まで冷却した後に、1規定塩酸と酢酸エチルを加えて分液した後に、得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去した後に、表題の化合物を含む589mgの黄色油状物を得た。これ以上精製することなく、次の反応に使用した。

[1201] [参考例6]

4-(2-クロロピリジン-3-イル)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-5-オキソペンタン酸の合成

[化241]



[1202] 参考例5で得られた4-(2-クロロピリジン-3-イル)-5-(2,

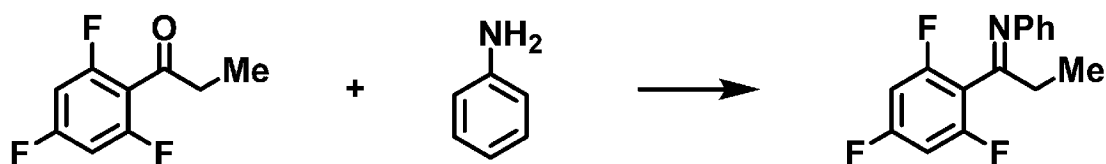
6-ジフルオロフェニル)-5-オキソペンタン酸エチル 589 mg を含む THF 15 ml と水 15 ml との混合溶液に、水酸化リチウム 1 水和物 335 mg を加えて、60℃で3.5時間攪拌した。室温まで冷却した後に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液とジエチルエーテルを加えて分液し、得られた水層に濃塩酸と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。次いで、減圧下にて溶媒留去した後に、表題の化合物を含む250 mgの黄色油状物を得た。これ以上精製することなく、次の反応に使用した。

[1203] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.30 (1H, dd, $J = 4.6, 1.8$ Hz), 7.67 (1H, dd, $J = 7.6, 1.8$ Hz), 7.36–7.34 (1H, m), 7.28–7.24 (1H, m), 6.90–6.85 (2H, m), 4.92 (1H, t, $J = 7.2$ Hz), 2.63–2.26 (5H, m).

[1204] [参考例7]

N-フェニル-1-(2,4,6-トリフルオロフェニル)プロパン-1-イミンの合成

[化242]



[1205] アニリン 3.64 ml、トリエチルアミン 7.41 ml を含むジクロロメタン溶液 30 ml に、四塩化チタン 4.37 ml を含むジクロロメタン溶液 15 ml を 0℃で滴下し、15分間攪拌した。次いで、1-(2,4,6-トリフルオロフェニル)プロパン-1-オン 5.00 g を含むジクロロメタン溶液 10 ml を 0℃で加えて、室温下で3.5時間攪拌した。得られた反応混合物に1規定塩酸とジクロロメタンを加えて分液した。得られた有機層を水にて洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去し

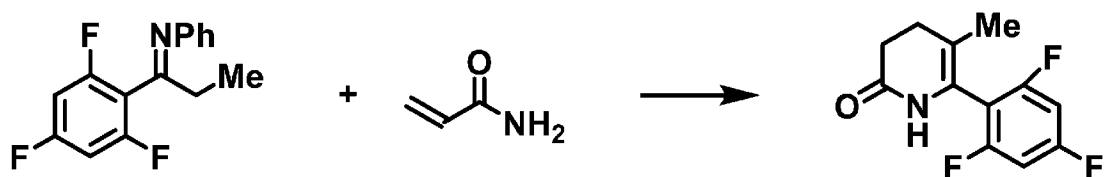
た後に、表題の化合物を含む 7.08 g の黄色油状物を得た。

[1206] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.16–7.11 (2H, m), 6.96–6.92 (1H, m), 6.69–6.67 (2H, m), 6.52–6.49 (2H, m), 2.73 (2H, q, $J = 7.4 \text{ Hz}$), 1.25 (3H, t, $J = 7.4 \text{ Hz}$).

[1207] [参考例 8]

5-メチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オンの合成

[化243]



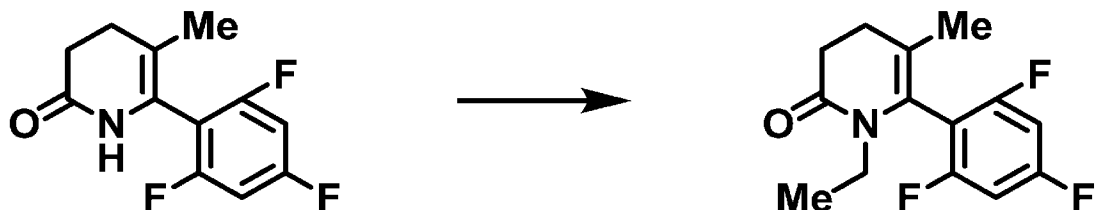
[1208] 参考例 7 で得られた N-フェニル-1-(2,4,6-トリフルオロフェニル)プロパン-1-イミン 7.08 g を含む 1,4-ジオキサン 70 ml に、塩化アルミニウム 3.90 g とアクリルアミド 2.08 g を加えて、90℃で 5 時間攪拌した。室温まで冷却した後に、1 規定塩酸と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 3.86 g の白色固体として得られた。

[1209] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 6.76–6.72 (2H, m), 6.58 (1H, s), 2.60–2.57 (2H, m), 2.47–2.45 (2H, m), 1.61 (3H, s).

[1210] [参考例 9]

1-エチル-5-メチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オンの合成

[化244]



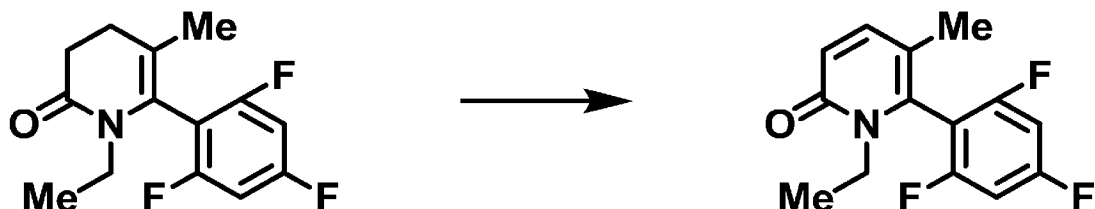
[1211] 5-メチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オン 3.86 g、ヨウ化エチル 5.12 ml と炭酸セシウム 20.85 g を含む DMF 40 ml を 60℃ で 10 時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた固体をジイソプロピルエーテルにて洗浄した。表題の化合物が 4.01 g の白色固体として得られた。

[1212] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 6.77–6.72 (2H, m), 3.32 (2H, q, $J = 7.1 \text{ Hz}$), 2.59–2.56 (2H, m), 2.37–2.35 (2H, m), 0.92 (3H, t, $J = 7.1 \text{ Hz}$).

[1213] [参考例10]

1-エチル-5-メチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成

[化245]



[1214] 参考例9で得られた1-エチル-5-メチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オン 4.00 g、2,3-ジクロロ-5,6-ジシアノ-p-ベンゾキノン 6.75 g を含むトルエン溶液 60 ml を 120℃ で 5 時間攪拌した。さらに反応

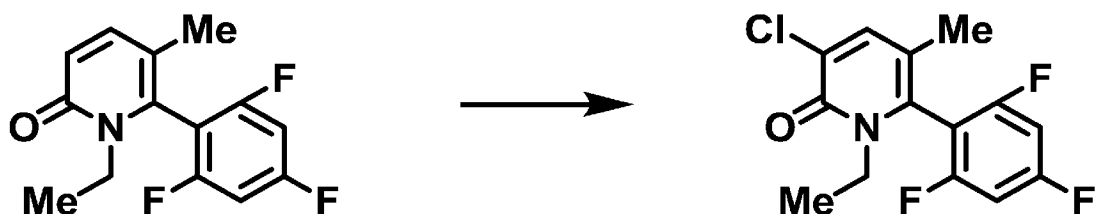
混合物に、2, 3-ジクロロ-5, 6-ジシアノ-p-ベンゾキノン 1.69 gを加えて、120℃で2時間攪拌した。室温まで冷却した後に、得られた反応混合物を濾過した。有機層を減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製して、次いで固体をジイソプロピルエーテルにて洗浄した。表題の化合物が3.50 gの白色固体として得られた。

[1215] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.26 (1H, d, $J = 9.5$ Hz), 6.88–6.84 (2H, m), 6.64 (1H, d, $J = 9.5$ Hz), 3.82 (2H, q, $J = 7.1$ Hz), 1.81 (3H, s), 1.10 (3H, t, $J = 7.1$ Hz).

[1216] [参考例 11]

3-クロロ-1-エチル-5-メチル-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成

[化246]



[1217] 1-エチル-5-メチル-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 97 mg、N-クロロスクシンイミド 49 mgを含むDMF溶液 3 mlを70℃で4時間攪拌した。さらに反応混合物にN-クロロスクシンイミド 32 mgを加えて、70℃で1時間攪拌した。室温まで冷却した後に、水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が86 mgの白色固体として得られた。

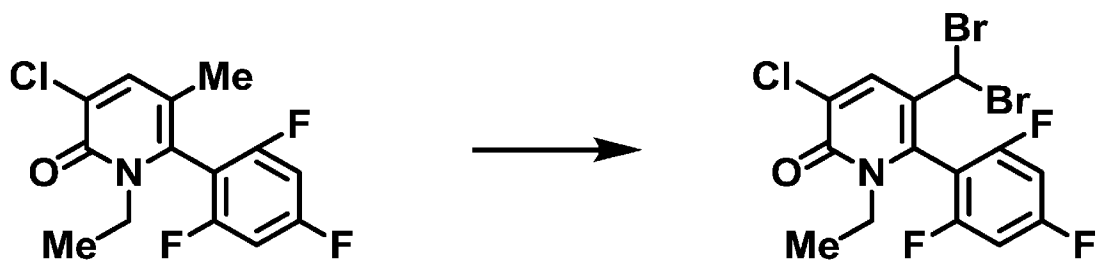
[1218] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.50 (1H, s), 6.

8.9–6.85 (2H, m), 3.87 (2H, q, $J = 7.1$ Hz), 1.82 (3H, s), 1.13 (3H, t, $J = 7.1$ Hz).

[1219] [参考例 12]

3-クロロ-5-(ジブロモメチル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2-オンの合成

[化247]



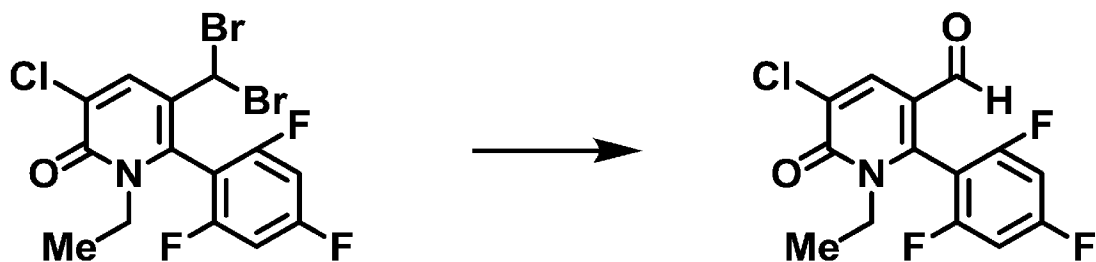
[1220] 3-クロロ-1-エチル-5-メチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 3.86 gを含むクロロベンゼン溶液 70 mlに、N-ブロモスクシンイミド 4.78 gとアゾビスイソブチロニトリル 113.9 mgを加えて、110℃で1時間攪拌した。室温まで冷却した後に、水とジクロロメタンを加えて分液した。得られた有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液と飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が5.40 gの褐色油状物として得られた。

[1221] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.13 (1H, s), 6.97–6.93 (2H, m), 5.96 (1H, s), 3.81 (2H, q, $J = 7.1$ Hz), 1.14 (3H, t, $J = 7.1$ Hz).

[1222] [参考例 13]

5-クロロ-1-エチル-6-オキソ-2-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-1,6-ジヒドロピリジン-3-カルボアルデヒドの合成

[化248]



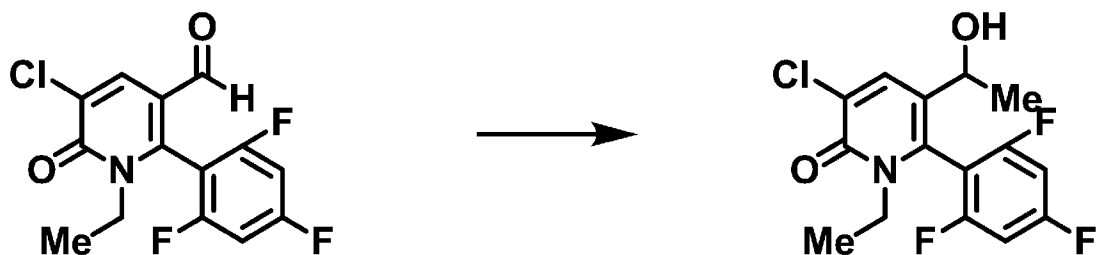
- [1223] 3-クロロ-5-(ジブロモメチル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2-オン 5.40 gを含むアセトニトリル溶液95 mlに、硝酸銀 5.99 gを含む水溶液47 mlを加えて、室温下で1時間攪拌した。反応混合物をセライト濾過し、酢酸エチルで洗浄した。得られた有機層を水、1規定塩酸、および飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた固体をジイソプロピルエーテルにて洗浄した。表題の化合物が3.56 gの白色固体として得られた。

- [1224] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.23 (1H, s), 8.12 (1H, s), 6.97-6.94 (2H, m), 3.94 (2H, q, $J = 7.1 \text{ Hz}$), 1.20 (3H, t, $J = 7.1 \text{ Hz}$).

- [1225] [参考例14]

3-クロロ-1-エチル-5-(1-ヒドロキシエチル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成

[化249]



- [1226] 5-クロロ-1-エチル-6-オキソ-2-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-1,6-ジヒドロピリジン-3-カルボアルデヒド 1.13

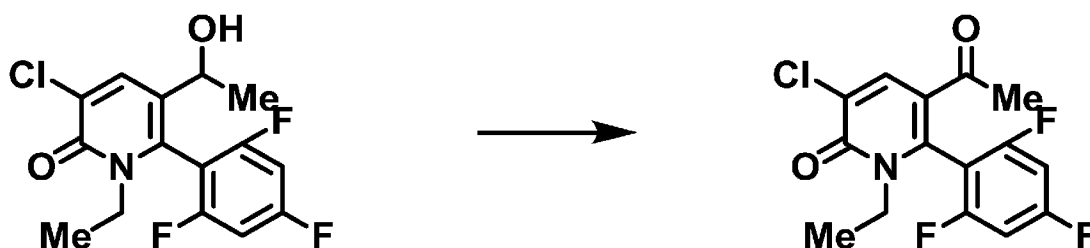
gを含むTHF溶液 12 mlに、3 mol/lのメチルマグネシウムクロリドのTHF溶液 1.32 mlを -78°C で滴下して20分間攪拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄して、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が920 mgの白色固体として得られた。

[1227] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.85 (1H, s), 6.92–6.86 (2H, m), 4.24 (1H, dq, $J = 2.8, 6.4$ Hz), 3.85–3.81 (2H, m), 1.64 (1H, d, $J = 2.8$ Hz), 1.30 (3H, d, $J = 6.4$ Hz), 1.13 (3H, t, $J = 7.0$ Hz).

[1228] [参考例15]

5-アセチル-3-クロロ-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成

[化250]



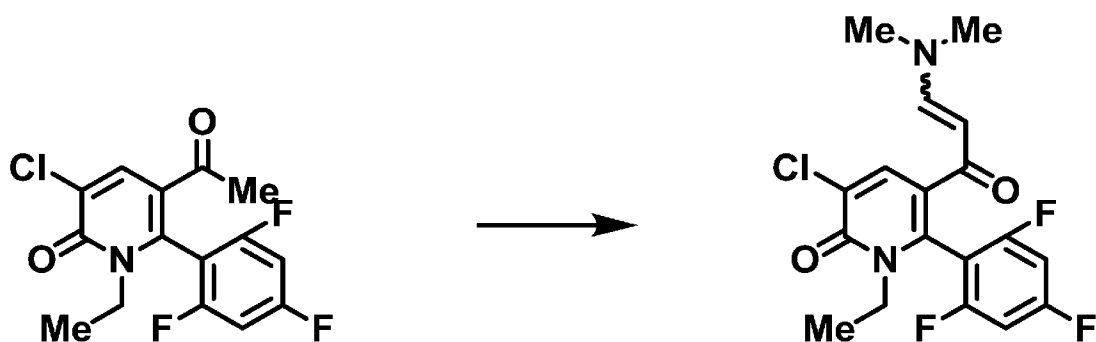
[1229] 3-クロロ-1-エチル-5-(1-ヒドロキシエチル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 910 mgを含むジクロロメタン溶液 18 mlに、デス・マーチンペルヨージナン(1,1,1-トリアセトキシ-1,1-ジヒドロ-1,2-ベンゾヨードキソール-3-(1H)-オン) 1.28 gを加えて室温で1時間攪拌した。反応混合物に酢酸エチルを加えてセライト濾過した。有機層を減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が870 mgの白色固体として得られた。

[1230] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.02 (1H, s), 6.83–6.81 (2H, m), 3.91 (2H, q, $J = 7.1$ Hz), 2.31 (3H, s), 1.14 (3H, t, $J = 7.1$ Hz).

[1231] [参考例16]

3-クロロ-5-(3-(ジメチルアミノ)アクリロイル)-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オンの合成

[化251]



[1232] 5-アセチル-3-クロロ-1-エチル-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-2(1H)-オン 870 mg に、N,N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール 8 ml を加えて、100℃で5時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に酢酸エチルと水を加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が859 mgの黄色固体として得られた。

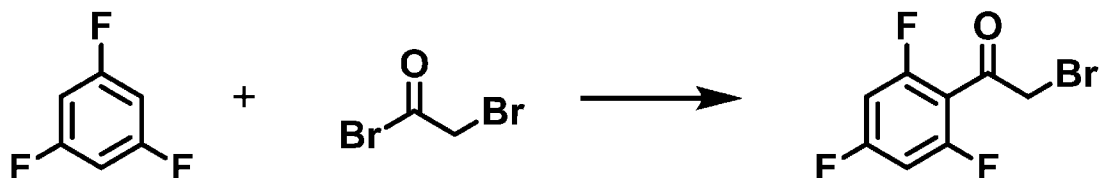
[1233] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.88 (1H, s), 7.48 (1H, d, $J = 12.2$ Hz), 6.79–6.77 (2H, m), 5.08 (1H, d, $J = 12.2$ Hz), 3.92 (2H, q, $J = 7.1$ Hz), 3.08 (3H, s), 2.81 (3H, s), 1.16 (3H, t

, $J = 7.1 \text{ Hz}$).

[1234] [参考例 17]

2-ブロモ-1-(2,4,6-トリフルオロフェニル)エタン-1-オンの合成

[化252]



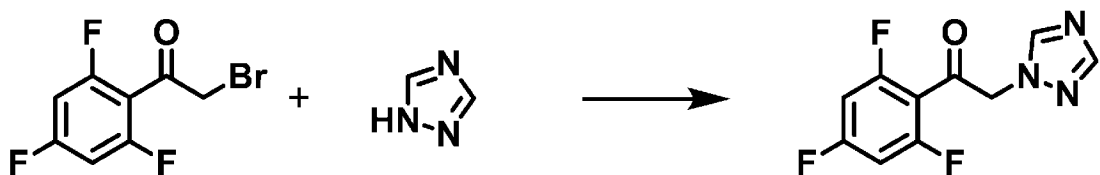
[1235] 1,3,5-トリフルオロベンゼン 5.50 g、塩化アルミニウム 1.1 g を含むジクロロメタン溶液 100 ml にブromoアセチルブロミド 4.33 ml を 0℃ で滴下し、反応混合物を加熱還流下で 15 時間攪拌した。室温まで冷却した後に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液とジクロロメタンを加えてセライト濾過した。有機層と水層を分液した後に、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 4.26 g の油状物として得られた。

[1236] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 6.79–6.76 (2H, m), 4.33–4.33 (2H, m).

[1237] [参考例 18]

2-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)-1-(2,4,6-トリフルオロフェニル)エタン-1-オンの合成

[化253]



[1238] 2-ブロモ-1-(2,4,6-トリフルオロフェニル)エタン-1-オン 4.26 g、1H-1,2,4-トリアゾール 2.56 g、トリエチ

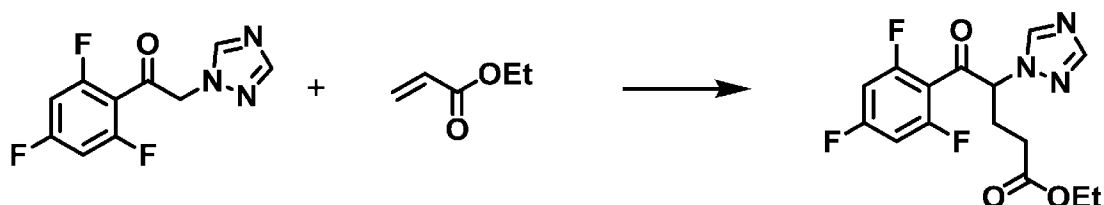
ルアミン 2.37 ml を含む酢酸エチル溶液を加熱還流下で 1.5 時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物をセライト濾過して、酢酸エチルで洗浄した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 1.22 g の茶色固体として得られた。

[1239] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.22 (1H, s), 7.99 (1H, s), 6.81–6.79 (2H, m), 5.46–5.45 (2H, m).

[1240] [参考例 19]

5-オキソ-4-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)-5-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ペンタン酸エチルの合成

[化254]



[1241] 2-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)-1-(2,4,6-トリフルオロフェニル)エタン-1-オン 1.43 g を含む THF 溶液 14 ml に、カリウム t-ブトキシド 133 mg とアクリル酸エチル 712 μl を加えて、室温下で 40 分間攪拌した。これに飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した後に、得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が 828 mg の茶色油状物として得られた。

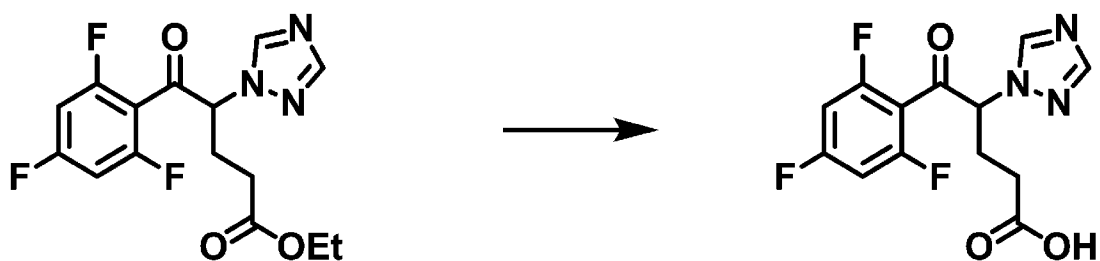
[1242] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.22 (1H, s), 7.90 (1H, s), 6.71–6.65 (2H, m), 5.79–5.76 (1H, m), 4.13 (2H, q, $J = 7.2$ Hz), 2.67–2.63 (1H, m), 2.43–2.

3.5 (2H, m), 2.12–2.07 (1H, m), 1.25 (3H, t, J = 7.2 Hz).

[1243] [参考例20]

5-オキソ-4-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)-5-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ペンタン酸の合成

[化255]



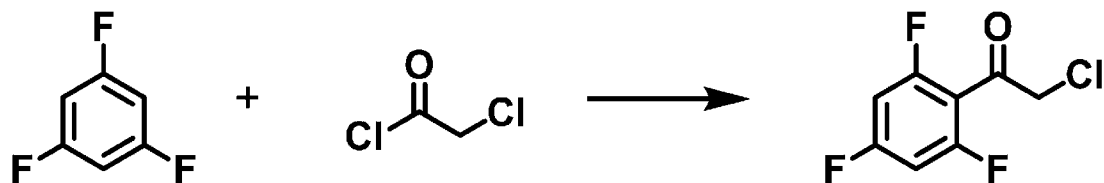
[1244] 5-オキソ-4-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)-5-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ペンタン酸エチル 828 mg を含む THF 8 ml と水 4 ml との混合溶液に、水酸化リチウム 1 水和物 305 mg を加えて、室温下で 1.5 時間攪拌した。反応混合物にジエチルエーテルを加えて分液し、得られた水層に濃塩酸と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。次いで、減圧下にて溶媒留去した後に、表題の化合物を含む 709 mg の茶色固体を得た。これ以上精製することなく、次の反応に使用した。

[1245] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.26 (1H, s), 7.91 (1H, s), 6.70–6.67 (2H, m), 5.77–5.75 (1H, m), 3.52 (1H, br s), 2.68–2.65 (1H, m), 2.51–2.44 (2H, m), 2.25–2.18 (1H, m).

[1246] [参考例21]

2-クロロ-1-(2,4,6-トリフルオロフェニル)エタン-1-オンの合成

[化256]



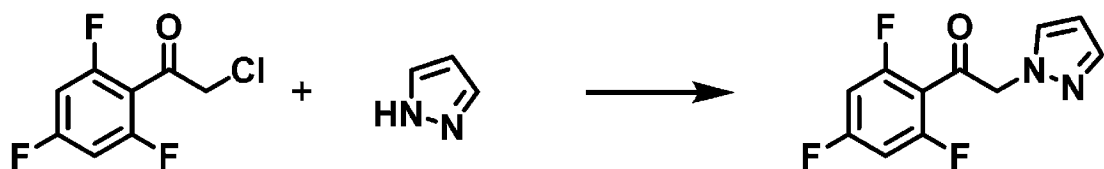
[1247] 1, 3, 5-トリフルオロベンゼン 12.0 ml、塩化アルミニウム 30.9 g、クロロアセチルクロリド 11.1 mlを含むジクロロエタン溶液28.0 mlを70℃で1時間撹拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に氷水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液と飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、表題の化合物を含む24.8 gの淡黄色固体を得た。これ以上精製することなく、次の反応に使用した。

[1248] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 6.80–6.76 (2H, m), 4.51 (2H, t, $J = 1.1 \text{ Hz}$).

[1249] [参考例22]

2-(1H-ピラゾール-1-イル)-1-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)エタン-1-オンの合成

[化257]



[1250] 参考例21で得られた2-クロロ-1-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)エタン-1-オン 7.28 g、1H-ピラゾール 11.9 gを含むメチルイソブチルケトン溶液70.0 mlを120℃で5.5時間撹拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に酢酸エチルと1規定塩酸を加えて分液した。得られた有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液と飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化

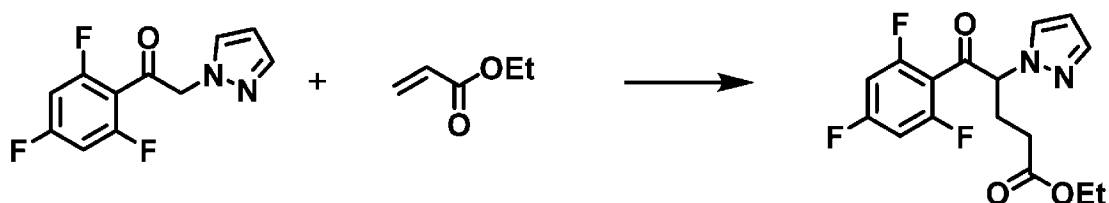
合物が3.74 gの褐色固体として得られた。

[1251] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.55 (1H, d, $J = 1.7$ Hz), 7.49 (1H, d, $J = 2.2$ Hz), 6.77–6.72 (2H, m), 6.34 (1H, dd, $J = 2.2, 1.7$ Hz), 5.37 (2H, t, $J = 1.2$ Hz).

[1252] [参考例23]

5-オキソ-4-(1H-ピラゾール-1-イル)-5-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ペンタン酸エチルの合成

[化258]



[1253] 2-(1H-ピラゾール-1-イル)-1-(2,4,6-トリフルオロフェニル)エタン-1-オン 3.74 gを含むTHF溶液 37.0 mlに、カリウム *t*-ブトキシド 349 mgとアクリル酸エチル 1.86 mlを加えて、40℃で55分間攪拌した。室温まで冷却した後に、飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去した後に、表題の化合物を含む5.33 gの赤褐色油状物を得た。これ以上精製することなく、次の反応に使用した。

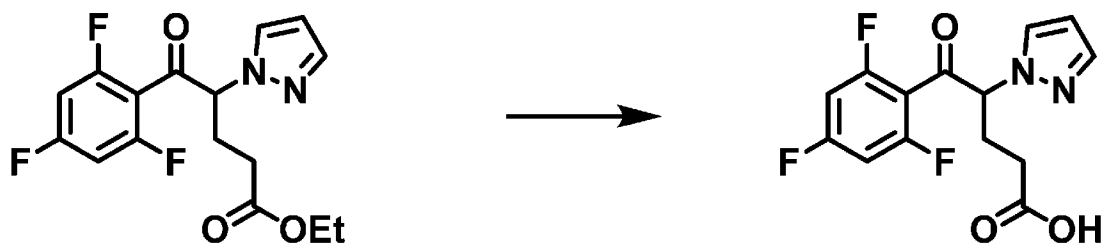
[1254] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.47 (1H, d, $J = 2.4$ Hz), 7.45 (1H, d, $J = 1.8$ Hz), 6.64–6.59 (2H, m), 6.22 (1H, dd, $J = 2.4, 1.8$ Hz), 5.57 (1H, dd, $J = 10.4, 4.9$ Hz), 4.13 (2H, q, $J = 7.1$ Hz), 2.66–2.59 (1H, m), 2.43–

2.41 (1H, m), 2.33–2.31 (1H, m), 2.15–2.11 (1H, m), 1.25 (3H, t, J = 7.1 Hz).

[1255] [参考例24]

5-オキソ-4-(1H-ピラゾール-1-イル)-5-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ペンタン酸の合成

[化259]

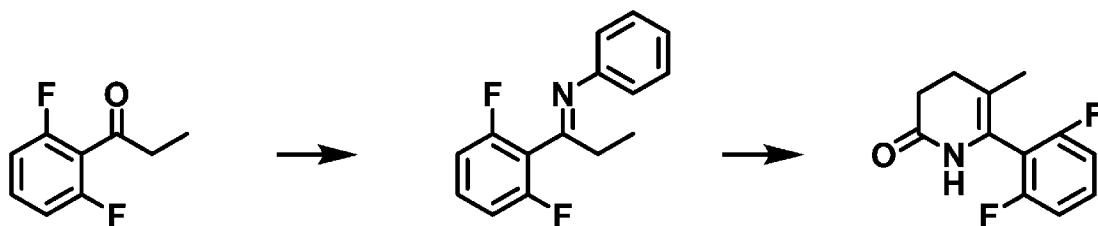


[1256] 参考例23で得られた5-オキソ-4-(1H-ピラゾール-1-イル)-5-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ペンタン酸エチル 5.33 gを含むTHF 20 mlに、水酸化リチウム1水和物 1.96 gを含む水溶液10 mlを加えて、室温で25分間攪拌した。反応混合物にジエチルエーテルを加えて分液し、得られた水層に濃塩酸と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。次いで、減圧下にて溶媒留去した後に、表題の化合物を含む3.66 gの茶色固体を得た。これ以上精製することなく、次の反応に使用した。

[1257] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.49 (1H, d, J = 2.4 Hz), 7.48 (1H, d, J = 1.8 Hz), 6.65–6.62 (2H, m), 6.25 (1H, dd, J = 2.4, 1.8 Hz), 5.63 (1H, dd, J = 10.2, 4.7 Hz), 2.69–2.61 (1H, m), 2.44–2.37 (2H, m), 2.21–2.15 (1H, m).

[1258] [参考例25]

[化260]



[1259] ステップ1：1－（2，6－ジフルオロフェニル）－N－フェニルプロパン－1－イミンの合成

アニリン 11.74 g とトリエチルアミン 17.01 g を含む塩化メチレン溶液 100 ml に、四塩化チタン 23.91 g を含む塩化メチレン溶液 50 ml を氷冷下で滴下した。該反応液に1－（2，6－ジフルオロフェニル）プロパン－1－オン 14.30 g を含む塩化メチレン溶液 30 ml を滴下した後に、氷冷から室温まで昇温して終夜撹拌した。得られた反応混合物に1規定塩酸を加えて分液し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、表題の化合物を含む21.10 g の濃緑色油状物質が得られた。これ以上精製することなく、次の反応に使用した。

[1260] ステップ2：6－（2，6－ジフルオロフェニル）－5－メチル－3，4－ジヒドロピリジン－2（1H）－オンの合成

ステップ1で得られた1－（2，6－ジフルオロフェニル）－N－フェニルプロパン－1－イミン 21.10 g と塩化アルミニウム 12.33 g を含むジオキサン溶液 200 ml にアクリルアミド モノマー 6.57 g を加えて、90℃で3時間撹拌した。該反応混合物を半分程度の量まで減圧下で溶媒留去した後に、1規定塩酸と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。得られた固体をイソプロピルエーテルで洗浄し、表題の化合物が11.65 g の白色固体として得られた。

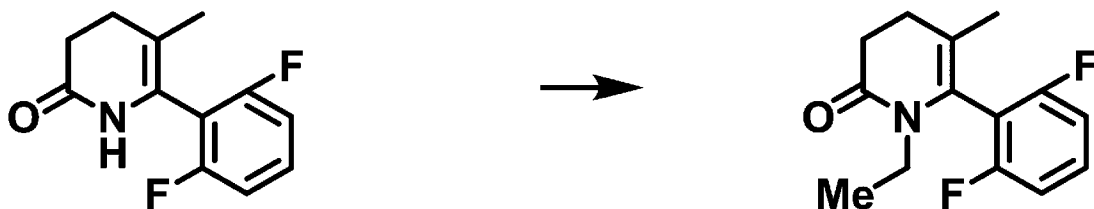
[1261] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.36–7.34 (1H, m), 6.97–6.94 (2H, m), 6.52 (1H, br

s), 2.61–2.59 (2H, m), 2.48–2.47 (2H, m), 1.63 (3H, s).

[1262] [参考例26]

6-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-エチル-5-メチル-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オンの合成

[化261]



[1263] 6-(2,6-ジフルオロフェニル)-5-メチル-3,4-ジヒドロピリジン-2(1H)-オン 12.40g、炭酸セシウム 54.30g およびヨウ化エチル 25.99gを含むDMF溶液 120mlを50℃で3.5時間攪拌した。次いで炭酸セシウム 27.15g およびヨウ化エチル 13.01gを追加した後に、50℃で2時間、さらに60℃で1.5時間攪拌した。室温まで冷却後、該反応混合物を濾過することにより不溶物を除去した。濾液を減圧下にて溶媒留去した後に、酢酸エチルと水を加えて分液した。得られた有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液および飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた固体をイソプロピルエーテルで洗浄した。表題の化合物が11.98gの白色固体として得られた。

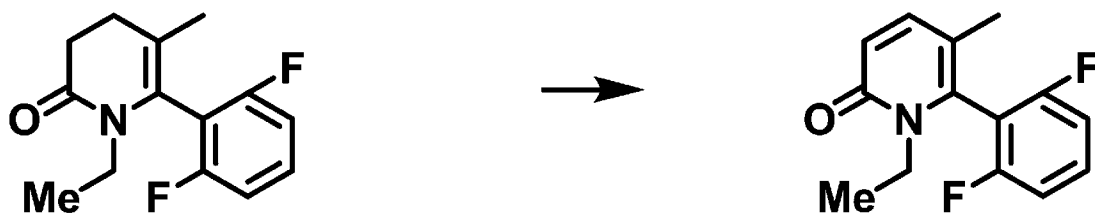
[1264] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.38–7.35 (1H, m), 6.97–6.96 (2H, m), 3.33 (2H, q, $J = 7.1 \text{ Hz}$), 2.60–2.58 (2H, m), 2.38–2.36 (2H, m), 1.59 (3H, s), 0.91 (3H, t, $J = 7.1 \text{ Hz}$).

[1265] [参考例27]

6-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-エチル-5-メチルピリジン

－ 2（ 1 H）－ オンの合成

[化262]



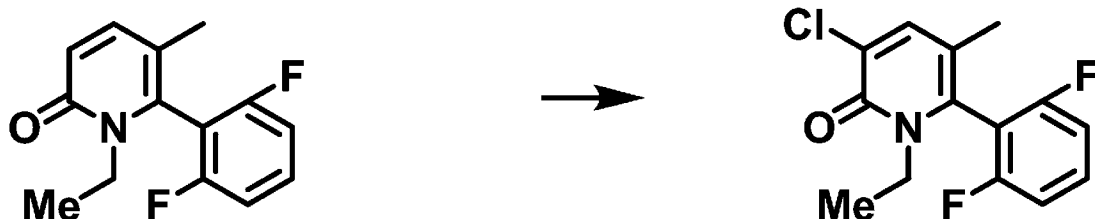
[1266] 6－（ 2， 6－ジフルオロフェニル）－ 1－エチル－ 5－メチル－ 3， 4－ジヒドロピリジン－ 2（ 1 H）－オン 11.98 gと 2， 3－ジクロロ－ 5， 6－ジシアノ－ p－ベンゾキノン 21.65 gを含むトルエン溶液 170 mlを 120℃で 1.5時間撹拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物を濾過することにより不溶物を除去した。濾液を減圧下で溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。得られた固体をイソプロピルエーテルで洗浄し、表題の化合物が 9.34 gの淡黄色固体として得られた。

[1267] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.50－7.49 (1 H, m), 7.27 (2 H, d, $J = 9.5 \text{ Hz}$), 7.09－7.06 (2 H, m), 6.63 (1 H, d, $J = 9.5 \text{ Hz}$), 3.83 (2 H, q, $J = 7.1 \text{ Hz}$), 1.80 (3 H, s), 1.10 (3 H, t, $J = 7.1 \text{ Hz}$).

[1268] [参考例 28]

3－クロロ－ 6－（ 2， 6－ジフルオロフェニル）－ 1－エチル－ 5－メチルピリジン－ 2（ 1 H）－オンの合成

[化263]



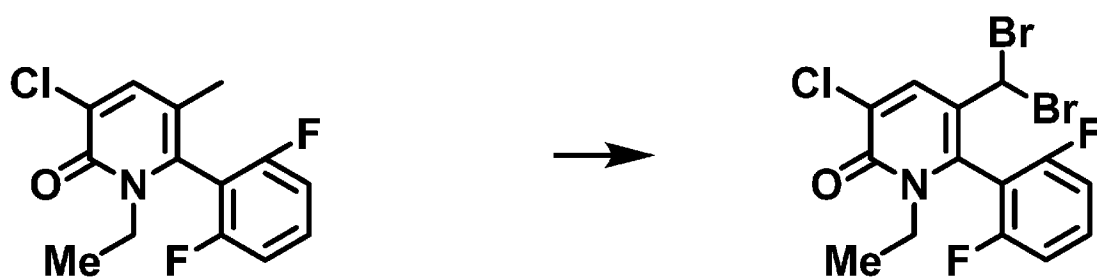
[1269] 6-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-エチル-5-メチルピリジン-2(1H)-オン 11.36 g と N-クロロスクシンイミド 6.69 g を含む DMF 溶液 110 ml を 70℃ で 50 分間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物を減圧下で溶媒留去した。これに酢酸エチルと水を加えて分液した後に、得られた有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液および飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた固体をイソプロピルエーテルで洗浄した。表題の化合物が 11.41 g の白色固体として得られた。

[1270] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.53–7.49 (1H, m), 7.50 (1H, s), 7.09–7.07 (2H, m), 3.88 (2H, q, $J = 7.1 \text{ Hz}$), 1.81 (3H, s), 1.12 (3H, t, $J = 7.1 \text{ Hz}$).

[1271] [参考例 29]

3-クロロ-5-(ジブロモメチル)-6-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-エチルピリジン-2(1H)-オンの合成

[化264]



[1272] 3-クロロ-6-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-エチル-5-メチルピリジン-2(1H)-オン 12.65 g を含むクロロベンゼン溶液 230 ml に、N-ブロモスクシンイミド 16.67 g とアゾビスイソブチロニトリル 366 mg を加えて、110℃ で 50 分間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に水とジクロロメタンを加えて分液した。得られた有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた固体をイソプロピルエーテルで

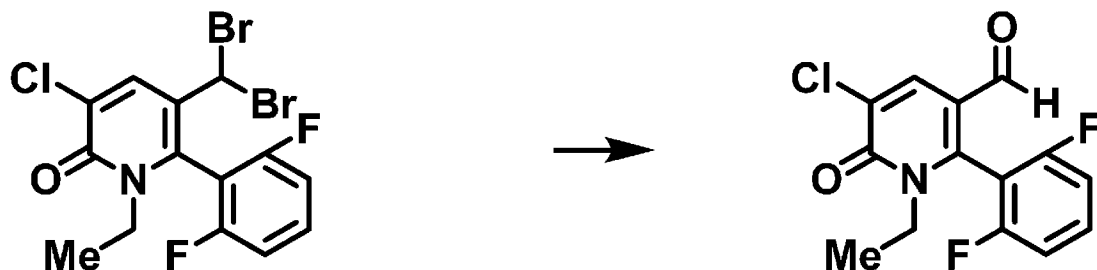
洗浄した。表題の化合物が 16.88 g の淡褐色固体として得られた。

[1273] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.13 (1H, s), 7.65–7.63 (1H, m), 7.18 (2H, dd, $J = 8.5, 6.8$ Hz), 5.96 (1H, s), 3.82 (2H, q, $J = 7.1$ Hz), 1.13 (3H, t, $J = 7.1$ Hz).

[1274] [参考例30]

5-クロロ-2-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-エチル-6-オキソ-1,6-ジヒドロピリジン-3-カルボアルデヒドの合成

[化265]



[1275] 3-クロロ-5-(ジブロモメチル)-6-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-エチルピリジン-2(1H)-オン 18.95 g を含むアセトニトリル 380 ml に、硝酸銀 21.87 g を含む水溶液 190 ml を加えて室温で15分間攪拌した。得られた反応混合物を濾過することにより不溶物を除去した。濾液を減圧下にて溶媒留去した後に、水と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を1規定塩酸と飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去した後に、得られた固体をイソプロピルエーテルで洗浄した。表題の化合物が 11.37 g の淡黄色固体として得られた。

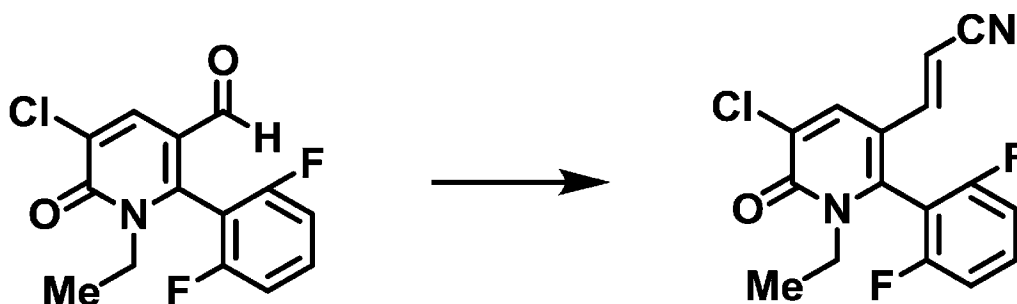
[1276] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.19 (1H, t, $J = 1.0$ Hz), 8.13 (1H, s), 7.67–7.63 (1H, m), 7.18–7.16 (2H, m), 3.94 (2H, q, $J = 7.1$ Hz), 1.19 (3H, t, J

= 7.1 Hz).

[1277] [参考例 3 1]

(E)-3-(5-クロロ-1-エチル-6-オキソ-2-(2,6-ジフルオロフェニル)-1,6-ジヒドロピリジン-3-イル)アクリロニトリルの合成

[化266]



[1278] 60%水素化ナトリウム 202 mgを含むTHF溶液 10 mlに、シアノメチルホスホン酸ジエチル 792 μ lを加えて0℃で30分間撹拌した。次いで、5-クロロ-2-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-エチル-6-オキソ-1,6-ジヒドロピリジン-3-カルボアルデヒド 500 mgを加えて0℃で4時間撹拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去した後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が343 mgの白色固体として得られた。

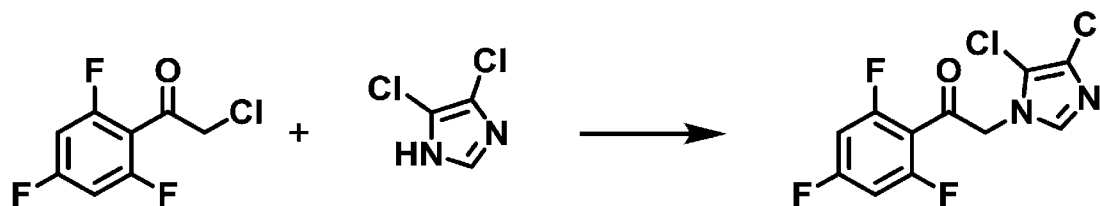
[1279] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.78 (1H, s), 7.67-7.63 (1H, m), 7.18-7.16 (2H, m), 6.58 (1H, d, $J = 16.4$ Hz), 5.59 (1H, d, $J = 16.4$ Hz), 3.89 (2H, q, $J = 7.1$ Hz), 1.15 (3H, t, $J = 7.1$ Hz).

[1280] [参考例 3 2]

2-(4,5-ジクロロ-1H-イミダゾール-1-イル)-1-(2,

4, 6-トリフルオロフェニル) エタン-1-オンの合成

[化267]



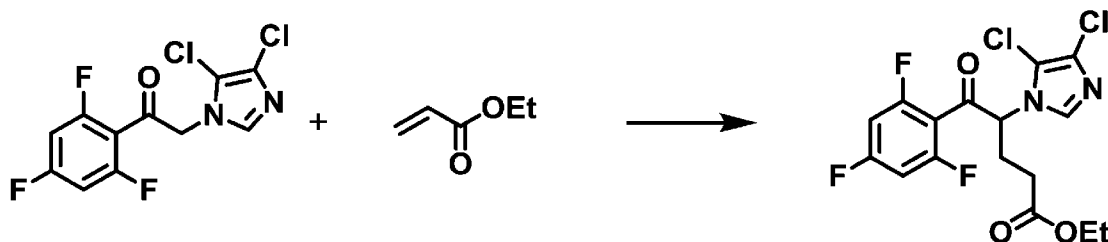
[1281] 参考例21で得られた2-クロロ-1-(2,4,6-トリフルオロフェニル)エタン-1-オン 2.12g、4,5-ジクロロイミダゾール 1.70g、トリエチルアミン1.45mlを含む酢酸エチル溶液20.0mlを90℃で3時間攪拌した。次いで、この溶液に4,5-ジクロロイミダゾール 1.70gを加えて、90℃で2時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に酢酸エチルと1規定塩酸を加えて分液した。得られた有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液と飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製した。表題の化合物が1.96gの白色固体として得られた。

[1282] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.44 (1H, s), 6.84-6.82 (2H, m), 5.14 (2H, s).

[1283] [参考例33]

4-(4,5-ジクロロ-1H-イミダゾール-1-イル)-5-オキソ-5-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ペンタン酸エチルの合成

[化268]



[1284] 参考例32で得られた2-(4,5-ジクロロ-1H-イミダゾール-1-イル)-1-(2,4,6-トリフルオロフェニル)エタン-1-オン

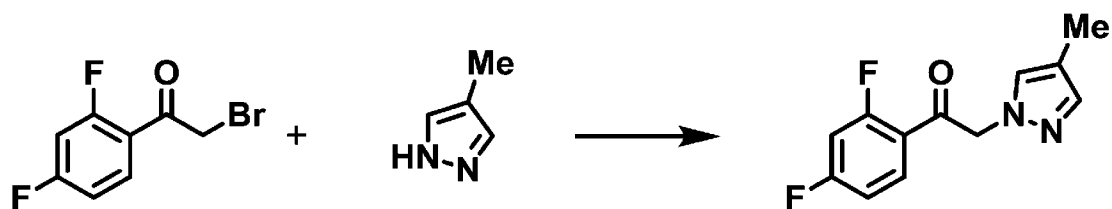
1. 96 gを含むTHF溶液 20.0 mlに、カリウム t-ブトキシド 142 mgとアクリル酸エチル 0.73 mlを加えて、室温で5.5時間攪拌した。次いで、この溶液にカリウム t-ブトキシド 71 mgとアクリル酸エチル 173 μ lを加えて、室温で1時間攪拌した。得られた溶液に、飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去した後に、表題の化合物を含む2.61 gの赤黒色油状物を得た。これ以上精製することなく、次の反応に使用した。

[1285] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.48 (1H, s), 6.76–6.74 (2H, m), 5.59 (1H, dd, $J = 10.3, 4.6$ Hz), 4.19–4.10 (2H, m), 2.63–2.58 (1H, m), 2.41–2.36 (1H, m), 2.28–2.16 (2H, m), 1.28–1.23 (3H, m).

[1286] [参考例34]

1-(2,4-ジフルオロフェニル)-2-(4-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)エタン-1-オンの合成

[化269]



2-ブロモ-1-(2,4-ジフルオロフェニル)エタン-1-オン 10.1 g、4-メチル-1H-ピラゾール 4.23 gを含むメチルイソブチルケトン溶液 30.0 mlを120℃で1時間攪拌した。室温まで冷却した後に、反応混合物に酢酸エチルと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒留去をした後に、得られた残渣をイソプロピルエーテルに

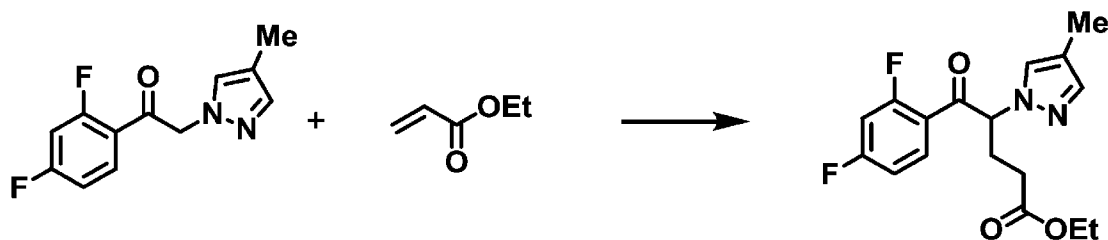
て洗浄した。表題の化合物が4.78gの褐色固体として得られた。

[1287] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.02 (1H, td, $J = 8.5, 6.4$ Hz), 7.40 (1H, s), 7.25–7.25 (1H, m), 7.04–7.00 (1H, m), 6.97–6.92 (1H, m), 5.45 (2H, d, $J = 3.7$ Hz), 2.13 (3H, s).

[1288] [参考例35]

5-(2,4-ジフルオロフェニル)-4-(4-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)-5-オキソペンタン酸エチルの合成

[化270]



[1289] 参考例34で得られた1-(2,4-ジフルオロフェニル)-2-(4-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)エタン-1-オン 4.69gを含むTHF溶液 40.0mlに、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン 2.94mlとアクリル酸エチル 2.25mlを加えて、室温で1.5時間攪拌した。得られた溶液に、飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液した。得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下にて溶媒留去した後に、表題の化合物を含む4.79gの黒赤色油状物を得た。これ以上精製することなく、次の反応に使用した。

[1290] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.87 (1H, td, $J = 8.6, 6.4$ Hz), 7.32 (1H, s), 7.28 (1H, s), 6.97–6.93 (1H, m), 6.85–6.81 (1H, m), 5.74 (1H, dd, $J = 10.4, 4.3$ Hz), 4.13 (2H, q, $J = 7.2$ Hz)

z), 2.50–2.47 (1H, m), 2.32–2.25 (3H, m), 2.06 (3H, s), 1.25 (3H, t, J = 7.2 Hz).

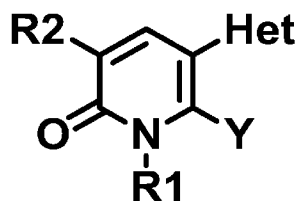
[1291] 表5に、前記した実施例に準じて合成した化合物を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

[1292] 表5中、Phはフェニル基を表し、2-Thioは、チオフェン-2-イル基を表し、3-Thioは、チオフェン-3-イル基を表し、3-Pyは、ピリジン-3-イル基を表し、3-Pyraは、1H-ピラゾール-3-イル基を表し、5-Pyraは、1H-ピラゾール-5-イル基を表し、1-Pyraは、1H-ピラゾール-1-イル基を表し、5-Oxaは、オキサゾール-5-イル基を表し、2-Oxaは、オキサゾール-2-イル基を表し、1H-1,2,4-triazol-1-ylは、1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル基を表し、1-Pyrrolylは、1H-ピロール-1-イル基を表し、4-Pyrrolylは、1H-ピロール-4-イル基を表し、1-Imidaは1H-イミダゾール-1-イル基を表し、1H-tetrazol-1-ylは、1H-テトラゾール-1-イル基を表す。

[1293] 例えば、表5中の「2,4,6-tri-F-Ph」との記載は、2位と4位と6位にフッ素原子が結合しているフェニル基であることを意味し、「2-Cl-3-Py」との記載は、2位に塩素原子が結合しているピリジン-3-イル基であることを意味し、他の記載も同様である。

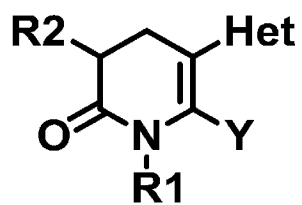
[1294] 表5中、構造Aは以下を示す。

[化271]



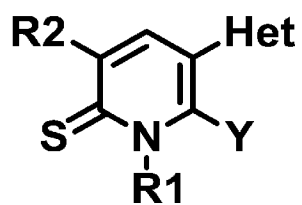
[1295] 表5中、構造Bは以下を示す。

[化272]



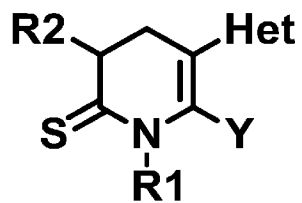
[1296] 表 5 中、構造 C は以下を示す。

[化273]



[1297] 表 5 中、構造 D は以下を示す。

[化274]



[1298]

[表5-1]

表 5

化合物	構造	R1	R2	Het	Y
1	B	Me	H	2-Thio	2,6-di-F-Ph
2	B	Et	H	2-Thio	2,6-di-F-Ph
3	B	Me	H	3-Thio	2,6-di-F-Ph
4	B	Et	H	3-Thio	2,6-di-F-Ph
5	A	Et	H	2-Thio	2,6-di-F-Ph
6	A	Et	H	5-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
7	A	Et	Cl	5-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
8	A	Et	Cl	1,3-dioxan-2-yl	2,4,6-tri-F-Ph
9	A	Et	Cl	1,3-dioxolan-2-yl	2,4,6-tri-F-Ph
10	A	Et	Cl	1,3-dioxan-2-yl	2,6-di-F-4-MeO-Ph
11	A	Et	Cl	1,3-dioxan-2-yl	2,6-di-F-Ph
12	A	Et	Cl	1,3-dioxolan-2-yl	2,6-di-F-4-MeO-Ph
13	A	Et	Cl	1,3-dioxolan-2-yl	2,6-di-F-Ph
14	A	Me	H	2-Thio	2,6-di-F-Ph
15	A	Me	H	3-Thio	2,6-di-F-Ph
16	A	Et	H	3-Thio	2,6-di-F-Ph
17	A	Et	H	2-Cl-3-Py	2,6-di-F-Ph
18	A	Et	Cl	2-Cl-3-Py	2,6-di-F-Ph
19	A	Et	Cl	1,4-di-Me-3-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
20	A	Et	Cl	1-Me-5-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
21	A	Et	Cl	4-Br-1-Me-5-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
22	A	Et	Cl	4-Cl-1-Me-5-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
23	A	Et	Cl	4-Br-1-Me-5-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
24	A	Et	Cl	4-Br-1-Me-3-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
25	B	Et	H	1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
26	A	Et	H	1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
27	A	Et	H	4-Cl-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
28	A	Et	Cl	1-Me-5-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
29	A	Et	Cl	4-Cl-1-Me-5-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
30	B	Et	H	1-Pyra	2,6-di-F-Ph
31	A	Et	H	1-Pyra	2,6-di-F-Ph
32	A	Et	Cl	5-Oxa	2-Cl-4-F-Ph
33	A	Et	Cl	5-Oxa	2-Cl-4-MeO-Ph
34	A	Et	Cl	1H-1,2,4-triazol-1-yl	2,4,6-tri-F-Ph
35	A	Et	Cl	5-Br-1H-1,2,4-triazol-1-yl	2,4,6-tri-F-Ph
36	A	Et	Cl	5-Oxa	2,4,6-tri-F-Ph
37	A	Et	Cl	5-Oxa	2,6-di-F-4-MeO-Ph
38	A	Et	Cl	4-Me-5-Oxa	2-Cl-4-F-Ph
39	A	Et	Cl	4-Me-5-Oxa	2-Cl-4-MeO-Ph
40	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
41	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
42	A	Et	Cl	5-Oxa	2,6-di-F-Ph

[表5-2]

表 5 の続き

化合物	構造	R1	R2	Het	Y
43	A	Et	Cl	4-Me-5-Oxa	2,6-di-F-Ph
44	A	Et	H	2-Br-3-Thio	2,6-di-F-Ph
45	A	Et	Cl	2-Br-3-Thio	2,6-di-F-Ph
46	A	Et	Br	5-Br-1H-1,2,4-triazol-1-yl	2,4,6-tri-F-Ph
47	A	Et	Br	1H-1,2,4-triazol-1-yl	2,4,6-tri-F-Ph
48	A	Et	Cl	5-I-1H-1,2,4-triazol-1-yl	2,4,6-tri-F-Ph
49	A	Et	Cl	4-Br-5-Oxa	2,6-di-F-Ph
50	A	Et	Cl	4-Cl-5-Oxa	2,6-di-F-Ph
51	A	Et	Cl	4-F-5-Oxa	2,6-di-F-Ph
52	A	Et	H	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
53	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
54	A	Et	Br	2-Br-3-Thio	2,6-di-F-Ph
55	A	Et	Br	2-Cl-3-Py	2,6-di-F-Ph
56	A	F2CHCH2-	H	2-Cl-3-Py	2,6-di-F-Ph
57	A	F2CHCH2-	Cl	2-Cl-3-Py	2,6-di-F-Ph
58	A	F3CCH2-	H	2-Cl-3-Py	2,6-di-F-Ph
59	A	F2CHCH2-	Br	2-Cl-3-Py	2,6-di-F-Ph
60	A	F3CCH2-	Cl	2-Cl-3-Py	2,6-di-F-Ph
61	A	Et	H	2-Cl-3-Py	2,4,6-tri-F-Ph
62	A	Et	Cl	2-Cl-3-Py	2,4,6-tri-F-Ph
63	A	Et	Br	2-Cl-3-Py	2,4,6-tri-F-Ph
64	A	F3CCH2-	Br	2-Cl-3-Py	2,6-di-F-Ph
65	A	Et	I	2-Cl-3-Py	2,6-di-F-Ph
66	A	Et	Me	2-Cl-3-Py	2,6-di-F-Ph
67	A	F2CHCH2-	H	2-Cl-3-Py	2,4,6-tri-F-Ph
68	A	F2CHCH2-	Cl	2-Cl-3-Py	2,4,6-tri-F-Ph
69	A	F2CHCH2-	Br	2-Cl-3-Py	2,4,6-tri-F-Ph
70	A	Et	Cl	4-Br-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
71	A	Et	Br	4-Cl-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
72	A	Et	Cl	4-Br-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
73	A	Et	Br	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
74	A	Et	Cl	4-I-5-Oxa	2,6-di-F-Ph
75	A	Et	Cl	2,4-di-I-5-Oxa	2,6-di-F-Ph
76	A	Et	H	4-Br-3,5-di-Me-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
77	A	Et	Br	4-Br-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
78	A	Et	Br	4-Br-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
79	A	Et	H	2-Cl-3-Py	2,6-di-F-4-MeO-Ph
80	A	Et	Cl	2-Cl-3-Py	2,6-di-F-4-MeO-Ph
81	A	Et	Br	2-Cl-3-Py	2,6-di-F-4-MeO-Ph
82	A	Et	H	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
83	A	Et	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
84	A	Et	Cl	1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph

[表5-3]

表 5 の続き

化合物	構造	R1	R2	Het	Y
85	A	Et	Cl	4-Me-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
86	A	Et	Me	4-Me-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
87	A	Et	Cl	2-Cl-5-Oxa	2,6-di-F-Ph
88	A	Et	Cl	3-N≡C-4-Pyrrolyl	2,6-di-F-Ph
89	A	Et	Br	5-Oxa	2,4,6-tri-F-Ph
90	A	Et	Br	5-Oxa	2,6-di-F-4-MeO-Ph
91	A	Et	Cl	4-MeO-5-Oxa	2,6-di-F-Ph
92	A	Et	Cl	2-I-5-Oxa	2,6-di-F-Ph
93	A	Et	H	3,5-di-Me-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
94	A	Et	H	3,5-di-Me-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
95	A	Et	H	4-Cl-3,5-di-Me-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
96	A	Et	Br	2,4-di-Br-5-Oxa	2,4,6-tri-F-Ph
97	A	Et	Br	4-Br-5-Oxa	2,4,6-tri-F-Ph
98	A	Me	H	2-Cl-3-Py	2,4,6-tri-F-Ph
99	A	Me	H	2-Cl-3-Py	2,6-di-F-Ph
100	A	Me	Cl	2-Cl-3-Py	2,4,6-tri-F-Ph
101	A	Et	Br	4-Me-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
102	A	Et	Br	2,4-di-Br-5-Oxa	2,6-di-F-4-MeO-Ph
103	A	Et	Br	4-Br-5-Oxa	2,6-di-F-4-MeO-Ph
104	A	Me	Br	2-Cl-3-Py	2,4,6-tri-F-Ph
105	A	Me	Cl	2-Cl-3-Py	2,6-di-F-Ph
106	A	Me	Br	2-Cl-3-Py	2,6-di-F-Ph
107	A	Et	Br	4-Cl-5-Oxa	2,4,6-tri-F-Ph
108	A	Et	H	4-Br-3-Me-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
109	A	Et	H	3,4-di-Me-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
110	A	F2CHCH2-	Cl	4-Cl-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
111	A	F2CHCH2-	Cl	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
112	A	Et	Cl	4-Cl-5-Oxa	2,4,6-tri-F-Ph
113	A	Et	Cl	4-Br-5-Oxa	2,4,6-tri-F-Ph
114	A	Et	Cl	2,4-di-Cl-5-Oxa	2,6-di-F-4-MeO-Ph
115	A	Et	Cl	4-Cl-5-Oxa	2,6-di-F-4-MeO-Ph
116	A	Et	Cl	2,4-di-Br-5-Oxa	2,6-di-F-4-MeO-Ph
117	A	Et	Br	4-Br-3,5-di-Me-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
118	A	Et	Cl	4-Br-5-Oxa	2,6-di-F-4-MeO-Ph
119	A	Et	Cl	5-Oxa	2,6-di-F-4-MeHN-Ph
120	A	Et	Cl	4-F-5-Oxa	2,4,6-tri-F-Ph
121	A	F3CCH2-	Cl	4-Cl-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
122	A	F3CCH2-	Cl	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
123	A	Et	Cl	4-HC(=O)-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
124	A	Et	Cl	4-F2HC-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
125	A	Et	Cl	2,5-di-Me-1-Pyrrolyl	2,4,6-tri-F-Ph
126	A	Et	Cl	2,5-di-Me-1-Pyrrolyl	2,6-di-F-4-MeO-Ph

[表5-4]

表 5 の続き

化合物	構造	R1	R2	Het	Y
127	A	Et	Cl	4-F-5-Oxa	2,6-di-F-4-MeO-Ph
128	A	Et	Cl	4-MeO-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
129	A	Et	Cl	5-EtOC(=O)-1-Imida	2,4,6-tri-F-Ph
130	A	Et	Cl	2-MeO-5-Oxa	2,6-di-F-Ph
131	A	Et	Cl	2-Me2N-5-Oxa	2,6-di-F-Ph
132	A	Et	Cl	1-Pyrrolyl	2,4,6-tri-F-Ph
133	A	Et	Cl	2,5-di-Cl-1-Pyrrolyl	2,4,6-tri-F-Ph
134	A	Et	Cl	2-MeNH-5-Oxa	2,6-di-F-Ph
135	A	Et	Cl	2-H2N-5-Oxa	2,6-di-F-Ph
136	A	Et	H	4,5-di-Cl-1-Imida	2,4,6-tri-F-Ph
137	A	Et	Cl	2,4,5-tri-Cl-1-Imida	2,4,6-tri-F-Ph
138	A	Et	Cl	4,5-di-Cl-1-Imida	2,4,6-tri-F-Ph
139	A	Et	Br	4,5-di-Cl-1-Imida	2,4,6-tri-F-Ph
140	A	Et	I	4-Cl-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
141	A	Et	H	4-Cl-3-Me-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
142	A	Et	Cl	4-Cl-3-Me-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
143	A	Et	Cl	4-Cl-3-Me-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
144	A	Et	Br	4-Cl-3-Me-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
145	A	Et	H	4-Cl-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
146	A	Et	Br	4-Cl-3-Me-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
147	A	Et	Br	4-Br-3-Me-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
148	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
149	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-F-4-MeO-Ph
150	A	Et	Br	4-Cl-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
151	A	Et	Br	4-Br-3-Me-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
152	A	Et	Br	4-Cl-1-Pyra	2-F-4-MeO-Ph
153	A	Et	H	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
154	A	Et	F3C-	4-F3C-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
155	A	Et	Cl	4-F3C-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
156	A	Et	H	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
157	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
158	A	Et	Br	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
159	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-4-MeO-Ph
160	A	Et	Cl	4-I-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
161	A	Et	Cl	4-NO2-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
162	A	Et	Cl	5-MeO-2-Oxa	2,6-di-F-Ph
163	A	Et	Cl	4-MeC(=O)NH-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
164	A	Et	H	4-Cl-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
165	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
166	A	Et	Br	4-Cl-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
167	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-Br-4-MeO-Ph
168	A	Et	H	4-Cl-1-Pyra	4-F-2-Me-Ph

[表5-5]

表 5 の続き

化合物	構造	R1	R2	Het	Y
169	A	Et	H	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-Ph
170	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	4-F-2-Me-Ph
171	A	Et	Br	4-Cl-1-Pyra	4-F-2-Me-Ph
172	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-Ph
173	A	Et	Br	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-Ph
174	A	Me	H	4-Cl-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
175	A	Me	Cl	4-Cl-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
176	A	Me	Br	4-Cl-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
177	A	Me	Cl	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
178	A	Me	Br	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
179	A	Et	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Cl-Ph
180	A	Et	Br	4-Me-1-Pyra	2-Cl-Ph
181	A	Et	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Cl-Ph
182	A	Et	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
183	A	Et	H	4-Cl-1-Pyra	2-Br-Ph
184	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-4-OH-Ph
185	C	Et	H	4-Cl-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
186	A	F2CHCH2-	H	4-Me-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
187	A	Me	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
188	A	Me	Br	4-Me-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
189	A	Me	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
190	A	F2CHCH2-	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
191	A	Et	H	4-F-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
192	A	Et	Cl	4-F-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
193	A	F2CHCH2-	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
194	A	Et	Br	4-F-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
195	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-Br-Ph
196	A	Et	Br	4-Cl-1-Pyra	2-Br-Ph
197	A	Et	H	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-6-F-Ph
198	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-6-F-Ph
199	A	Et	Br	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-6-F-Ph
200	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-4-EtO-Ph
201	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-4-HC≡C-CH2O-Ph
202	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-4-H2C=CH-CH2O-Ph
203	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeOCH2O-Ph
204	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeOCH2-CH2O-Ph
205	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeC(=O)O-Ph
206	A	Et	Me	4-Cl-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
207	A	F2CHCH2-	Br	4-Cl-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph

[表5-6]

表 5 の続き

化合物	構造	R1	R2	Het	Y
208	A	Et	H	4,5-di-Cl-1-Imida	2-Cl-Ph
209	A	Et	Cl	4,5-di-Cl-1-Imida	2-Cl-Ph
210	A	Et	Br	4,5-di-Cl-1-Imida	2-Cl-Ph
211	A	F2CHCH2-	H	4-Cl-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
212	A	F2CHCH2-	Cl	4-Cl-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
213	A	F2CHCH2-	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-F-4-MeO-Ph
214	A	F2CHCH2-	Br	4-Cl-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
215	A	F2CHCH2-	Br	4-Cl-1-Pyra	2-F-4-MeO-Ph
216	A	Et	H	4-Cl-1-Pyra	2-Br-6-F-Ph
217	A	Et	H	4-Cl-1-Pyra	2-F-Ph
218	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-Br-6-F-Ph
219	A	Et	Br	4-Cl-1-Pyra	2-Br-6-F-Ph
220	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-F-Ph
221	A	Et	Br	4-Cl-1-Pyra	2-F-Ph
222	A	F2CHCH2-	Br	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
223	A	Et	HC≡C-	4-Cl-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
224	A	Et	HC≡C-	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
225	A	Et	MeO-	4-Cl-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
226	A	Et	Br	4-Me-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
227	A	F2CHCH2-	H	4-Me-1-Pyra	2-Cl-Ph
228	A	Et	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
229	A	F2CHCH2-	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Cl-Ph
230	A	F2CHCH2-	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Cl-Ph
231	A	F2CHCH2-	H	4,5-di-Cl-1-Imida	2-Cl-Ph
232	A	F2CHCH2-	Cl	4,5-di-Cl-1-Imida	2-Cl-Ph
233	A	F2CHCH2-	H	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
234	A	F2CHCH2-	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
235	A	F2CHCH2-	Br	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
236	A	F2CHCH2-	Br	4,5-di-Cl-1-Imida	2-Cl-Ph
237	A	Et	Br	4-Me-1-Pyra	2-Me-Ph
238	A	Et	H	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
239	A	F2CHCH2-	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-4-MeO-Ph
240	A	F2CHCH2-	Br	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-4-MeO-Ph
241	A	Et	Br	4-Cl-1-Pyra	2-MeO-Ph
242	A	Et	H	4-Cl-1-Pyra	2-MeO-Ph
243	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-MeO-Ph
244	A	Et	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Me-Ph
245	A	Et	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Me-Ph
246	A	Et	H	4-Me-1-Pyra	2-MeO-Ph
247	A	Et	Br	4-Me-1-Pyra	2-MeO-Ph
248	A	Et	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-MeO-Ph
249	A	Et	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-MeO-Ph

[表5-7]

表 5 の続き

化合物	構造	R1	R2	Het	Y
250	A	Et	H	4-F-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
251	A	Et	Cl	4-F-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
252	A	Et	Br	4-F-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
253	A	Et	I	4-Cl-1-Pyra	2,6-di-F-3-I-4-MeO-Ph
254	A	F2CHCH2-	H	4-Me-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
255	A	F2CHCH2-	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
256	A	F2CHCH2-	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
257	A	Et	Br	4-Cl-1-Pyra	2-NO2-Ph
258	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-NO2-Ph
259	A	Et	H	4-Me-1-Pyra	2-F-Ph
260	A	Et	Br	4-Me-1-Pyra	2-F-Ph
261	A	Et	Cl	3-Cl-1H-1,2,4-triazol-1-yl	2,4,6-tri-F-Ph
262	A	Et	Br	3-Cl-1H-1,2,4-triazol-1-yl	2,4,6-tri-F-Ph
263	A	Et	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-F-Ph
264	A	Et	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-F-Ph
265	A	Et	HC(=O)-	4-Cl-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
266	A	Et	F2CH-	4-Cl-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
267	A	Et	Cl	3-Cl-1H-1,2,4-triazol-1-yl	2,6-di-F-4-MeO-Ph
268	A	Et	H	4-Me-1-Pyra	2-Br-Ph
269	A	Et	Br	4-Me-1-Pyra	2-Br-Ph
270	A	Et	Br	5-Br-4-Me-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
271	A	Et	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Br-Ph
272	A	Et	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Br-Ph
273	A	F2CHCH2-	H	4-Cl-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
274	A	F2CHCH2-	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
275	A	F2CHCH2-	Br	4-Cl-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
276	A	F2CHCH2-	H	4-Cl-1-Pyra	2-F-Ph
277	A	F2CHCH2-	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-F-Ph
278	A	F2CHCH2-	Br	4-Cl-1-Pyra	2-F-Ph
279	A	Et	Cl	4-Cl-1-Pyra	4-N≡C-2-F-Ph
280	A	Et	Br	4-Cl-1-Pyra	4-N≡C-2-F-Ph
281	A	Et	H	1H-tetrazol-1-yl	2,4,6-tri-F-Ph
282	A	F2CHCH2-	H	4-F-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
283	A	F2CHCH2-	Br	4-F-1-Pyra	2,4,6-tri-F-Ph
284	A	F2CHCH2-	H	4-F-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
285	A	F2CHCH2-	Cl	4-F-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
286	A	F2CHCH2-	Br	4-F-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
287	A	F2CHCH2-	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-Br-4-MeO-Ph
288	A	F2CHCH2-	Br	4-Cl-1-Pyra	2-Br-4-MeO-Ph
289	A	F2CHCH2-	H	4-Cl-1-Pyra	2-Br-Ph
290	A	F2CHCH2-	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-Br-Ph
291	A	F2CHCH2-	Br	4-Cl-1-Pyra	2-Br-Ph

[表5-8]

表 5 の続き

化合物	構造	R1	R2	Het	Y
292	A	F2CHCH2-	H	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-Ph
293	A	F2CHCH2-	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-Ph
294	A	F2CHCH2-	Br	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-Ph
295	B	Et	H	2-Cl-3-Thio	2,6-di-F-Ph
296	A	Et	H	2-Cl-3-Thio	2,6-di-F-Ph
297	A	Et	Cl	2,5-di-Cl-3-Thio	2,6-di-F-Ph
298	A	Et	Cl	2-Cl-3-Thio	2,6-di-F-Ph
299	A	Et	Br	2-Cl-3-Thio	2,6-di-F-Ph
300	A	Et	H	4-F-1-Pyra	2-F-4-MeO-Ph
301	A	Et	Cl	4-F-1-Pyra	2-F-4-MeO-Ph
302	A	Et	Br	4-F-1-Pyra	2-F-4-MeO-Ph
303	A	F2CHCH2-	H	4-Me-1-Pyra	2-Me-Ph
304	A	F2CHCH2-	Br	4-Me-1-Pyra	2-Me-Ph
305	A	F2CHCH2-	H	4-Me-1-Pyra	2-F-Ph
306	A	F2CHCH2-	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Me-Ph
307	A	F2CHCH2-	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Me-Ph
308	A	Et	H	4-F-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
309	A	F2CHCH2-	Br	4-Me-1-Pyra	2-F-Ph
310	A	F2CHCH2-	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-F-Ph
311	A	Et	H	4-F-1-Pyra	2,6-di-F-4-EtO-Ph
312	A	F2CHCH2-	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-F-Ph
313	A	Et	Br	4-F-1-Pyra	2-Cl-Ph
314	A	Et	Cl	4-F-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
315	A	Et	Br	4-F-1-Pyra	2,6-di-F-4-MeO-Ph
316	A	Et	Cl	4-F-1-Pyra	2,6-di-F-4-EtO-Ph
317	A	Et	Br	4-F-1-Pyra	2,6-di-F-4-EtO-Ph
318	A	Et	H	4-F-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
319	A	Et	Cl	4-F-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
320	A	Et	Br	4-F-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
321	A	Et	Br	4-Me-1-Pyra	2-Et-Ph
322	A	Et	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Et-Ph
323	A	F2CHCH2-	H	2-Br-3-Thio	2,6-di-F-Ph
324	A	F2CHCH2-	H	2,5-di-Br-3-Thio	2,6-di-F-Ph
325	A	F2CHCH2-	Br	2,5-di-Br-3-Thio	2,6-di-F-Ph
326	A	Et	H	4-F-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
327	A	Et	H	4-F-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
328	A	Et	Cl	4-F-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
329	A	Et	Br	4-F-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
330	A	Et	H	4-Me-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
331	A	Et	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
332	A	Et	Br	4-Me-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
333	A	Et	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph

[表5-9]

表 5 の続き

化合物	構造	R1	R2	Het	Y
334	A	Et	H	4-Me-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
335	A	Et	Br	4-Me-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
336	A	Et	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
337	A	Et	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
338	A	F2CHCH2-	H	4-Me-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
339	A	F2CHCH2-	Br	4-Me-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
340	A	F2CHCH2-	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
341	A	F2CHCH2-	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
342	A	F2CHCH2-	H	4-Me-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
343	A	F2CHCH2-	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
344	A	F2CHCH2-	Br	4-Me-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
345	A	F2CHCH2-	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
346	A	F2CHCH2-	Br	2-Br-3-Thio	2,6-di-F-Ph
347	A	F2CHCH2-	Cl	2-Br-3-Thio	2,6-di-F-Ph
348	A	F2CHCH2-	H	2-Br-5-Cl-3-Thio	2,6-di-F-Ph
349	A	F2CHCH2-	Cl	2-Br-5-Cl-3-Thio	2,6-di-F-Ph
350	A	Et	H	4-F-1-Pyra	2-Cl-Ph
351	A	Et	Cl	4-F-1-Pyra	2-Cl-Ph
352	A	Et	Cl	4-F-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
353	A	Et	Br	4-F-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
354	A	Et	H	4-F-1-Pyra	2-Br-4-MeO-Ph
355	A	Et	Cl	4-F-1-Pyra	2-Br-4-MeO-Ph
356	A	Et	H	4-F-1-Pyra	2-Br-Ph
357	A	Et	Cl	4-F-1-Pyra	2-Br-Ph
358	A	Et	Br	4-F-1-Pyra	2-Br-Ph
359	A	Et	H	3-Me-2-Thio	2,6-di-F-Ph
360	A	Et	H	4-F-1-Pyra	2-Br-6-F-Ph
361	A	Et	Cl	4-F-1-Pyra	2-Cl-4-MeO-Ph
362	A	Et	H	4-F-1-Pyra	2-Cl-4-MeO-Ph
363	A	Et	Br	4-F-1-Pyra	2-Cl-4-MeO-Ph
364	A	Et	H	3-Br-2-Thio	2,6-di-F-Ph
365	A	Et	Cl	3-Br-2-Thio	2,6-di-F-Ph
366	A	F2CHCH2-	H	2-Cl-3-Thio	2,6-di-F-Ph
367	A	Et	H	4-Me-1-Pyra	4-F-2-Me-Ph
368	A	Et	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-F-4-MeNH-Ph
369	A	Et	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	4-F-2-Me-Ph
370	A	Et	Br	4-Me-1-Pyra	4-F-2-Me-Ph
371	A	Et	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	4-F-2-Me-Ph
372	A	Et	H	4-Me-1-Pyra	2-F3C-Ph
373	A	Et	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-F-4-MeS-Ph
374	A	Et	Br	4-Me-1-Pyra	2-F3C-Ph
375	A	Et	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-F3C-Ph

[表5-10]

表 5 の続き

化合物	構造	R1	R2	Het	Y
376	A	NH2	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
377	A	Et	H	2-Me-3-Thio	2,6-di-F-Ph
378	A	Et	H	4-F-1-Pyra	2-Cl-6-F-Ph
379	A	Et	Cl	4-F-1-Pyra	2-Cl-6-F-Ph
380	A	Et	Br	4-F-1-Pyra	2-Cl-6-F-Ph
381	A	Et	Cl	3-Me-2-Thio	2,6-di-F-Ph
382	A	Et	H	4-F-1-Pyra	2-F-Ph
383	A	Et	Cl	4-F-1-Pyra	2-F-Ph
384	A	Et	Br	4-F-1-Pyra	2-F-Ph
385	A	F2CHCH2-	H	3-Me-2-Thio	2,6-di-F-Ph
386	A	Et	H	5-Br-3-Me-2-Thio	2,6-di-F-Ph
387	A	Et	Cl	5-Br-3-Me-2-Thio	2,6-di-F-Ph
388	A	Et	Br	5-Br-3-Me-2-Thio	2,6-di-F-Ph
389	A	Et	Br	3-Me-2-Thio	2,6-di-F-Ph
390	A	Et	Cl	2-Me-3-Thio	2,6-di-F-Ph
391	A	Et	Cl	4-F-1-Pyra	2-Br-6-F-Ph
392	A	Et	Br	4-F-1-Pyra	2-Br-6-F-Ph
393	A	Et	H	3-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
394	A	F2CHCH2-	H	3-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
395	A	Et	Cl	3-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
396	A	Et	Cl	3,5-di-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
397	A	Et	Br	3-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
398	A	Et	Br	5-Br-3-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
399	A	NH2	Br	2-Cl-3-Thio	2,6-di-F-Ph
400	A	F2CHCH2-	Br	5-Br-2-Cl-3-Thio	2,6-di-F-Ph
401	A	F2CHCH2-	H	5-Br-2-Cl-3-Thio	2,6-di-F-Ph
402	A	F2CHCH2-	Br	2-Cl-3-Thio	2,6-di-F-Ph
403	A	F2CHCH2-	Cl	5-Br-2-Cl-3-Thio	2,6-di-F-Ph
404	A	F2CHCH2-	Cl	2-Cl-3-Thio	2,6-di-F-Ph
405	A	F2CHCH2-	H	4-Me-1-Pyra	2-Br-Ph
406	A	Me	H	4-Me-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
407	A	F2CHCH2-	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Br-Ph
408	A	F2CHCH2-	Br	4-Me-1-Pyra	2-Br-Ph
409	A	F2CHCH2-	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Br-Ph
410	A	Me	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
411	A	Me	Br	4-Me-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
412	A	Me	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
413	A	Me	H	4-F-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
414	A	MeNH	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
415	A	Et	Br	3,5-di-Br-2-Thio	2,6-di-F-Ph
416	A	Et	Br	3-Br-2-Thio	2,6-di-F-Ph
417	A	Et	H	3,5-di-Br-2-Thio	2,6-di-F-Ph

[表5-11]

表 5 の続き

化合物	構造	R1	R2	Het	Y
418	A	F2CHCH2-	H	3-Br-2-Thio	2,6-di-F-Ph
419	A	F2CHCH2-	Cl	3-Br-5-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
420	A	F2CHCH2-	Cl	3-Br-2-Thio	2,6-di-F-Ph
421	A	F2CHCH2-	H	3-Br-5-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
422	A	F2CHCH2-	Br	3,5-di-Br-2-Thio	2,6-di-F-Ph
423	A	F2CHCH2-	Br	3-Br-2-Thio	2,6-di-F-Ph
424	A	F2CHCH2-	H	2-Me-3-Thio	2,6-di-F-Ph
425	A	F2CHCH2-	H	4-F-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
426	A	F2CHCH2-	Cl	4-F-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
427	A	Et	Br	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-4-MeO-Ph
428	A	Et	H	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-4-MeO-Ph
429	A	Me	Cl	2-Br-3-Thio	2,6-di-F-Ph
430	A	Me	Br	2-Br-3-Thio	2,6-di-F-Ph
431	A	Me	H	2-Me-3-Thio	2,6-di-F-Ph
432	A	F2CHCH2-	Br	5-Br-3-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
433	A	F2CHCH2-	Br	3-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
434	A	F2CHCH2-	H	5-Br-3-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
435	A	Me	H	3-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
436	A	F2CHCH2-	Cl	3,5-di-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
437	A	F2CHCH2-	Cl	3-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
438	A	F2CHCH2-	H	3,5-di-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
439	A	Me	Cl	3-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
440	A	Me	Cl	3,5-di-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
441	A	Me	Br	3-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
442	A	Me	Br	5-Br-3-Cl-2-Thio	2,6-di-F-Ph
443	A	F2CHCH2-	H	5-Br-3-Me-2-Thio	2,6-di-F-Ph
444	A	Et	Br	2-Me-3-Thio	2,6-di-F-Ph
445	A	F2CHCH2-	Cl	3-Me-2-Thio	2,6-di-F-Ph
446	A	F2CHCH2-	Br	3-Me-2-Thio	2,6-di-F-Ph
447	A	F2CHCH2-	H	4-F-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
448	A	F2CHCH2-	Cl	4-F-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
449	A	F2CHCH2-	Br	4-F-1-Pyra	2-Br-4-F-Ph
450	A	F2CHCH2-	Br	4-F-1-Pyra	2-Br-4-MeO-Ph
451	A	Me	H	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
452	A	Me	Cl	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
453	A	Me	Br	4-Cl-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
454	B	Me	H	2-Br-3-Thio	2,6-di-F-Ph
455	A	Me2N	Br	2-Cl-3-Thio	2,6-di-F-Ph
456	A	Me	H	2-Br-3-Thio	2,6-di-F-Ph
457	B	Me	H	3-Me-2-Thio	2,6-di-F-Ph
458	A	Et	H	2-Cl-3-Thio	2-Cl-4-F-Ph
459	A	Et	Br	2-Cl-3-Thio	2-Cl-4-F-Ph

[表5-12]

表 5 の続き

化合物	構造	R1	R2	Het	Y
460	A	Et	Cl	2-Cl-3-Thio	2-Cl-4-F-Ph
461	A	Me	Cl	4-F-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
462	A	Me	Br	4-F-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
463	A	Me	H	4-F-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
464	A	Me	Cl	4-F-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
465	A	Me	Br	4-F-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
466	A	Et	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-F-4-(pyrrolidin-1-yl)-Ph
467	A	NH ₂	Br	4-F-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
468	A	MeNH	Br	4-F-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
469	A	Et	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-F-4-(piperidin-1-yl)-Ph
470	A	Me ₂ N	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
471	A	Et	Br	4-Me-1-Pyra	2-N≡C-Ph
472	A	Et	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-N≡C-Ph
473	A	NH ₂	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
474	A	Me	H	4-Me-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
475	A	MeNH	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,6-di-F-Ph
476	A	Me	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
477	A	NH ₂	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
478	A	MeNH	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
479	A	Me ₂ N	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
480	A	F ₂ CHCH ₂ -	Cl	2-Me-3-Thio	2,6-di-F-Ph
481	A	Me	H	4-F-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
482	A	Me	Cl	4-F-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
483	A	Me	Br	4-F-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph
484	A	Me	Cl	2-Me-3-Thio	2,6-di-F-Ph
485	A	Et	H	4-Me-1-Pyra	4-Br-2-F-Ph
486	A	Et	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-N≡C-4-F-Ph
487	A	Me	H	4-Me-1-Pyra	2-F-Ph
488	A	Me	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-F-Ph
489	A	Me	Br	4-Me-1-Pyra	2-F-Ph
490	A	Me	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-F-Ph
491	A	Me	H	5-Br-2-Me-3-Thio	2,6-di-F-Ph
492	A	Me	Br	2-Me-3-Thio	2,6-di-F-Ph
493	A	F ₂ CHCH ₂ -	H	3-Thio	2,6-di-F-Ph
494	A	F ₂ CHCH ₂ -	Br	5-Br-2-Me-3-Thio	2,6-di-F-Ph
495	A	F ₂ CHCH ₂ -	Br	5-Br-2-BrCH ₂ -3-Thio	2,6-di-F-Ph
496	A	Me	H	3-Me-2-Thio	2,6-di-F-Ph
497	A	Et	H	2-Cl-3-Thio	2-Cl-4-MeO-Ph
498	A	Me	Cl	3-Me-2-Thio	2,6-di-F-Ph
499	A	Et	Br	2-Br-3-Thio	2,4-di-F-Ph
500	A	Et	H	2-Br-3-Thio	2,4-di-F-Ph

[表5-13]

表 5 の続き

化合物	構造	R1	R2	Het	Y
501	A	Et	Cl	2-Br-3-Thio	2,4-di-F-Ph
502	A	Et	Cl	2-Cl-3-Thio	2-Cl-4-MeO-Ph
503	A	Et	H	2-Me-3-Thio	2,4-di-F-Ph
504	A	Et	Br	2-Cl-3-Thio	2-Cl-4-MeO-Ph
505	A	Et	H	4-Me-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
506	A	Et	H	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2,4-di-F-Ph
507	A	Et	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	4-N≡C-2-F-Ph
508	A	Et	Cl	4-F-1-Pyra	4-N≡C-2-F-Ph
509	A	Me	Cl	4-F-1-Pyra	2-Cl-6-F-Ph
510	A	Me	Br	4-F-1-Pyra	2-Cl-6-F-Ph
511	A	Me	H	4-Me-1-Pyra	4-F-2-Me-Ph
512	A	Me	Cl	5-Cl-4-Me-1-Pyra	4-F-2-Me-Ph
513	A	Me	Br	4-Me-1-Pyra	4-F-2-Me-Ph
514	A	Me	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	4-F-2-Me-Ph
515	A	Me	Br	5-Cl-4-Me-1-Pyra	2-Cl-4-F-Ph

[1311] 次に、表 5 に記載の化合物に関して、表 6 にそれらの¹H-NMR データを示す。

[1312]

[表6-1]

表 6

化合物	¹ H-NMR
1	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.45-7.43 (1H, m), 7.04 (1H, dd, J = 5.3, 1.1 Hz), 6.98 (2H, dd, J = 8.2, 6.9 Hz), 6.84 (1H, dd, J = 5.0, 3.7 Hz), 6.76 (1H, dd, J = 3.7, 0.9 Hz), 2.92 (2H, dd, J = 8.9, 6.2 Hz), 2.88 (3H, s), 2.75 (2H, dd, J = 8.9, 6.2 Hz).
2	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.45-7.43 (1H, m), 7.03 (1H, dd, J = 5.0, 1.4 Hz), 6.97 (2H, dd, J = 8.5, 7.1 Hz), 6.83 (1H, dd, J = 5.0, 3.7 Hz), 6.73 (1H, dd, J = 3.7, 0.9 Hz), 3.42 (2H, q, J = 7.2 Hz), 2.90 (2H, dd, J = 9.4, 6.2 Hz), 2.73 (2H, dd, J = 8.7, 6.0 Hz), 0.97 (3H, t, J = 7.1 Hz).
3	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.35-7.33 (1H, m), 7.09 (1H, dd, J = 5.0, 3.2 Hz), 6.90 (2H, dd, J = 8.5, 7.1 Hz), 6.74 (1H, dd, J = 3.2, 1.4 Hz), 6.63 (1H, dd, J = 5.0, 1.4 Hz), 2.87 (3H, s), 2.83-2.69 (4H, m).
4	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.35-7.33 (1H, m), 7.08 (1H, dd, J = 5.0, 2.7 Hz), 6.89 (2H, dd, J = 8.2, 6.9 Hz), 6.71 (1H, dd, J = 3.2, 1.4 Hz), 6.63 (1H, dd, J = 5.0, 1.4 Hz), 3.41 (2H, q, J = 7.0 Hz), 2.81-2.69 (4H, m), 0.95 (3H, q, J = 7.9 Hz).
5	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.53 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.43 (1H, tt, J = 8.6, 6.3 Hz), 7.12 (1H, dd, J = 5.1, 1.2 Hz), 6.99-6.94 (2H, m), 6.83 (1H, dd, J = 5.1, 3.7 Hz), 6.73 (1H, dd, J = 3.7, 1.2 Hz), 6.72 (1H, d, J = 9.5 Hz), 3.90 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.15 (3H, t, J = 7.1 Hz).
6	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.48-7.45 (2H, m), 7.00 (2H, dd, J = 8.5, 7.1 Hz), 6.71 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.65 (1H, d, J = 3.9 Hz), 6.52 (1H, d, J = 3.9 Hz), 3.87 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.14 (3H, t, J = 7.1 Hz).
7	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.70 (1H, s), 7.49 (1H, tt, J = 8.5, 6.4 Hz), 7.00 (2H, dd, J = 8.5, 7.1 Hz), 6.66 (1H, d, J = 3.9 Hz), 6.56 (1H, d, J = 3.9 Hz), 3.92 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.16 (3H, t, J = 7.1 Hz).
8	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.91 (1H, s), 6.88-6.84 (2H, m), 4.75 (1H, s), 4.09-4.07 (2H, m), 3.85 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.60-3.57 (2H, m), 2.07-2.02 (1H, m), 1.30-1.27 (1H, m), 1.14 (3H, t, J = 7.1 Hz).
9	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.77 (1H, s), 6.87 (2H, td, J = 8.6, 1.8 Hz), 5.09 (1H, s), 4.06-4.02 (2H, m), 3.87-3.84 (4H, m), 1.15 (3H, t, J = 7.1 Hz).
10	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.91 (1H, s), 6.63-6.59 (2H, m), 4.77 (1H, s), 4.11-4.08 (2H, m), 3.89 (3H, s), 3.87 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.62-3.59 (2H, m), 2.10-2.06 (1H, m), 1.30-1.26 (1H, m), 1.13 (3H, t, J = 7.1 Hz).
11	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.93 (1H, s), 7.55 (1H, tt, J = 8.4, 6.4 Hz), 7.10-7.07 (2H, m), 4.74 (1H, s), 4.08-4.06 (2H, m), 3.86 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.56-3.53 (2H, m), 2.08-2.03 (1H, m), 1.28-1.24 (1H, m), 1.14 (3H, t, J = 7.1 Hz).
12	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.75 (1H, s), 6.62-6.60 (2H, m), 5.11 (1H, s), 4.07-4.05 (2H, m), 3.88-3.86 (7H, m), 1.14 (3H, t, J = 7.1 Hz).
13	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.77 (1H, s), 7.54 (1H, tt, J = 8.5, 6.4 Hz), 7.09 (2H, dd, J = 8.5, 7.0 Hz), 5.08 (1H, s), 4.05-4.03 (2H, m), 3.87-3.83 (4H, m), 1.14 (3H, t, J = 7.1 Hz).
14	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.56 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.45-7.43 (1H, m), 7.12 (1H, dd, J = 5.2, 1.2 Hz), 6.99-6.95 (2H, m), 6.84 (1H, dd, J = 5.0, 3.5 Hz), 6.74-6.73 (2H, m), 3.37 (3H, s).
15	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.47 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.40-7.38 (1H, m), 7.13 (1H, dd, J = 5.0, 3.1 Hz), 6.96-6.90 (2H, m), 6.89 (1H, dd, J = 2.9, 1.2 Hz), 6.75-6.72 (2H, m), 3.38 (3H, s).
16	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.44 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.39-7.37 (1H, m), 7.11 (1H, dd, J = 5.0, 2.9 Hz), 6.93-6.91 (2H, m), 6.89 (1H, dd, J = 2.9, 1.4 Hz), 6.75 (1H, dd, J = 4.9, 1.2 Hz), 6.72 (1H, d, J = 9.5 Hz), 3.90 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.14 (3H, t, J = 7.0 Hz).

[表6-2]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
17	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.23 (1H, dd, J = 4.9, 2.0 Hz), 7.42 (1H, dt, J = 7.6, 2.0 Hz), 7.36-7.29 (2H, m), 7.04 (1H, dd, J = 7.6, 4.9 Hz), 6.91-6.83 (2H, m), 6.76 (1H, d, J = 9.3 Hz), 3.96-3.87 (2H, m), 1.16 (3H, t, J = 7.1 Hz).
18	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.25 (1H, dd, J = 4.8, 1.9 Hz), 7.57 (1H, s), 7.43 (1H, dt, J = 7.6, 1.9 Hz), 7.38-7.30 (1H, m), 7.06 (1H, dd, J = 7.6, 4.8 Hz), 6.91-6.85 (2H, m), 4.01-3.92 (2H, m), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz).
19	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.60 (1H, s), 6.99 (1H, s), 6.67-6.65 (2H, m), 3.97 (2H, q, J = 7.2 Hz), 3.64 (3H, s), 1.87 (3H, d, J = 0.5 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.2 Hz).
20	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.53 (1H, s), 7.28 (1H, d, J = 2.0 Hz), 6.71-6.69 (2H, m), 5.93 (1H, d, J = 2.0 Hz), 3.94 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.69 (3H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz).
21	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.47 (1H, s), 7.32 (1H, s), 6.77-6.76 (1H, m), 6.69-6.64 (1H, m), 4.19-4.13 (1H, m), 3.87-3.81 (1H, m), 3.69 (3H, d, J = 1.5 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
22	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.48 (1H, s), 7.28 (1H, s), 6.78-6.76 (1H, m), 6.67-6.64 (1H, m), 4.19 (1H, dq, J = 13.5, 7.0 Hz), 3.81 (1H, dq, J = 13.5, 7.0 Hz), 3.68 (3H, d, J = 1.2 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.0 Hz).
23	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.45 (1H, s), 7.32 (1H, s), 6.48 (1H, dt, J = 11.2, 1.8 Hz), 6.41 (1H, dt, J = 11.2, 1.8 Hz), 4.12 (1H, dq, J = 13.5, 7.0 Hz), 3.91 (1H, dq, J = 13.5, 7.0 Hz), 3.80 (3H, s), 3.66 (3H, d, J = 1.2 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.0 Hz).
24	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.71 (1H, s), 7.26 (1H, s), 6.69-6.67 (2H, m), 3.97 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.69 (3H, s), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
25	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.47 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.14 (1H, d, J = 2.2 Hz), 6.69-6.63 (2H, m), 6.11 (1H, dd, J = 2.2, 2.0 Hz), 3.42 (2H, q, J = 7.2 Hz), 2.95-2.90 (2H, m), 2.88-2.83 (2H, m), 0.98 (3H, t, J = 7.2 Hz).
26	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.46-7.45 (2H, m), 7.29 (1H, d, J = 2.4 Hz), 6.75 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.72-6.68 (2H, m), 6.19-6.18 (1H, m), 3.89 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.17 (3H, t, J = 7.2 Hz).
27	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.40 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.37 (1H, s), 7.31 (1H, s), 6.75-6.72 (3H, m), 3.88 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.17 (3H, t, J = 7.0 Hz).
28	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.51 (1H, s), 7.28 (1H, d, J = 1.8 Hz), 6.44-6.42 (2H, m), 5.96 (1H, d, J = 1.8 Hz), 3.97 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.79 (3H, s), 3.68 (3H, s), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
29	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.46 (1H, s), 7.28 (1H, s), 6.49 (1H, ddd, J = 10.7, 2.2, 1.5 Hz), 6.40 (1H, ddd, J = 11.0, 2.2, 1.5 Hz), 4.17-4.10 (1H, m), 3.90-3.87 (1H, m), 3.80 (3H, s), 3.66 (3H, d, J = 1.2 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
30	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.47 (1H, d, J = 1.8 Hz), 7.34-7.32 (1H, m), 7.11 (1H, d, J = 2.4 Hz), 6.90-6.88 (2H, m), 6.06-6.06 (1H, m), 3.42 (2H, q, J = 7.0 Hz), 2.95-2.93 (2H, m), 2.88-2.85 (2H, m), 0.98 (3H, t, J = 7.0 Hz).
31	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.48 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.44 (1H, dd, J = 1.8, 0.9 Hz), 7.40-7.38 (1H, m), 7.27-7.27 (1H, m), 6.95-6.91 (2H, m), 6.75 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.14 (1H, dd, J = 2.4, 1.8 Hz), 3.89 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.17 (3H, t, J = 7.2 Hz).
32	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.00 (1H, s), 7.76 (1H, s), 7.37 (1H, dd, J = 8.3, 2.6 Hz), 7.31 (1H, dd, J = 8.6, 5.8 Hz), 7.21 (1H, ddd, J = 8.6, 7.6, 2.6 Hz), 5.77 (1H, s), 4.23-4.16 (1H, m), 3.62-3.56 (1H, m), 1.18 (3H, t, J = 7.0 Hz).
33	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.03 (1H, s), 7.76 (1H, s), 7.18 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.12 (1H, d, J = 2.8 Hz), 6.99 (1H, dd, J = 8.6, 2.8 Hz), 5.66 (1H, s), 4.23-4.16 (1H, m), 3.90 (3H, s), 3.68-3.61 (1H, m), 1.18 (3H, t, J = 7.0 Hz).

[表6-3]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
34	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.99 (1H, s), 7.87 (1H, s), 7.68 (1H, s), 6.76-6.74 (2H, m), 3.95 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.21 (3H, t, J = 7.2 Hz).
35	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.76 (1H, s), 7.60 (1H, s), 6.75-6.73 (2H, m), 3.97 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.22 (3H, t, J = 7.2 Hz).
36	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.94 (1H, s), 7.77 (1H, s), 6.93-6.86 (2H, m), 6.19 (1H, s), 3.95 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz).
37	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.98 (1H, s), 7.78 (1H, s), 6.66-6.61 (2H, m), 6.04 (1H, s), 3.98 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.89 (3H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz).
38	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.57 (1H, s), 7.53 (1H, s), 7.24 (1H, dd, J = 8.6, 5.8 Hz), 7.19 (1H, dd, J = 8.3, 2.4 Hz), 7.04 (1H, ddd, J = 8.6, 8.0, 2.4 Hz), 4.29-4.22 (1H, m), 3.60-3.53 (1H, m), 2.05 (3H, s), 1.15 (3H, t, J = 7.0 Hz).
39	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.55 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.11 (1H, d, J = 8.5 Hz), 6.93 (1H, d, J = 2.4 Hz), 6.80 (1H, dd, J = 8.5, 2.4 Hz), 4.30-4.22 (1H, m), 3.82 (3H, s), 3.65-3.57 (1H, m), 2.02 (3H, s), 1.14 (3H, t, J = 7.1 Hz).
40	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.66 (1H, s), 7.38 (1H, s), 7.32 (1H, s), 6.76-6.74 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).
41	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.67 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.28 (1H, s), 6.51-6.48 (2H, m), 3.95 (2H, q, J = 7.2 Hz), 3.83 (3H, s), 1.18 (3H, t, J = 7.2 Hz).
42	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.98 (1H, s), 7.75 (1H, s), 7.63-7.56 (1H, m), 7.15-7.10 (2H, m), 6.01 (1H, s), 3.96 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz).
43	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.59 (1H, s), 7.56 (1H, s), 7.43 (1H, tt, J = 8.6, 6.4 Hz), 6.99-6.94 (2H, m), 3.97 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.99 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
44	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.38-7.32 (2H, m), 7.00 (1H, d, J = 5.8 Hz), 6.91-6.89 (2H, m), 6.76 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.54 (1H, d, J = 5.8 Hz), 3.91 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.16 (3H, t, J = 7.0 Hz).
45	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.59 (1H, s), 7.37 (1H, tt, J = 8.6, 6.4 Hz), 7.01 (1H, d, J = 5.8 Hz), 6.92-6.90 (2H, m), 6.55 (1H, d, J = 5.8 Hz), 3.96 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
46	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.80 (1H, s), 7.76 (1H, s), 6.76-6.72 (2H, m), 3.97 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.22 (3H, t, J = 7.0 Hz).
47	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.99 (1H, s), 7.88 (1H, s), 7.87 (1H, s), 6.77-6.73 (2H, m), 3.95 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.21 (3H, t, J = 7.2 Hz).
48	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.79 (1H, s), 7.60 (1H, s), 6.74-6.72 (2H, m), 3.97 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.23 (3H, t, J = 7.2 Hz).
49	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.74 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.49-7.43 (1H, m), 7.01-6.97 (2H, m), 3.97 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
50	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.75 (1H, s), 7.56 (1H, s), 7.47 (1H, tt, J = 8.5, 6.3 Hz), 7.03-6.97 (2H, m), 3.97 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
51	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.75 (1H, s), 7.51 (1H, tt, J = 8.5, 6.3 Hz), 7.43 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.06-7.00 (2H, m), 3.95 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
52	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.44-7.42 (2H, m), 7.35 (1H, s), 7.28 (1H, s), 6.98-6.96 (2H, m), 6.74 (1H, d, J = 9.8 Hz), 3.88 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.16 (3H, t, J = 7.2 Hz).
53	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.68 (1H, s), 7.46-7.43 (1H, m), 7.36 (1H, s), 7.28 (1H, s), 6.99-6.97 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).
54	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.80 (1H, s), 7.37 (1H, tt, J = 8.4, 6.4 Hz), 7.01 (1H, d, J = 5.8 Hz), 6.91 (2H, dd, J = 8.4, 7.2 Hz), 6.54 (1H, d, J = 5.8 Hz), 3.96 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.17 (3H, t, J = 7.2 Hz).

[表6-4]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
55	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.25 (1H, dd, J = 4.8, 2.0 Hz), 7.78 (1H, s), 7.43 (1H, dt, J = 7.6, 1.7 Hz), 7.38-7.30 (1H, m), 7.07 (1H, dd, J = 7.6, 4.8 Hz), 6.91-6.85 (2H, m), 4.01-3.92 (2H, m), 1.18 (3H, t, J = 7.2 Hz).
56	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.25 (1H, dd, J = 4.9, 2.0 Hz), 7.44 (1H, dt, J = 7.6, 2.0 Hz), 7.42-7.33 (2H, m), 7.08 (1H, dd, J = 7.6, 4.9 Hz), 6.90-6.85 (2H, m), 6.79 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.16 (1H, tt, J = 56.4, 4.6 Hz), 4.28-4.08 (2H, m).
57	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.28 (1H, dd, J = 4.8, 2.0 Hz), 7.63 (1H, s), 7.47 (1H, dt, J = 7.5, 2.0 Hz), 7.41-7.35 (1H, m), 7.10 (1H, dd, J = 7.5, 4.8 Hz), 6.91-6.87 (2H, m), 6.19 (1H, tt, J = 56.4, 4.5 Hz), 4.34-4.25 (1H, m), 4.20-4.10 (1H, m).
58	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.24 (1H, dd, J = 4.9, 2.0 Hz), 7.45-7.41 (1H, m), 7.38-7.30 (2H, m), 7.07 (1H, dd, J = 7.6, 4.9 Hz), 6.88-6.79 (3H, m), 4.70 (1H, br s), 4.53 (1H, br s).
59	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.27 (1H, dd, J = 4.7, 1.9 Hz), 7.83 (1H, s), 7.46 (1H, dt, J = 7.6, 1.9 Hz), 7.41-7.34 (1H, m), 7.10 (1H, dd, J = 7.6, 4.7 Hz), 6.91-6.86 (2H, m), 6.19 (1H, tt, J = 56.3, 4.5 Hz), 4.35-4.24 (1H, m), 4.21-4.10 (1H, m).
60	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.28 (1H, dd, J = 4.7, 2.0 Hz), 7.60 (1H, s), 7.50-7.46 (1H, m), 7.42-7.34 (1H, m), 7.12 (1H, dd, J = 7.6, 4.7 Hz), 6.92-6.85 (2H, m), 4.88-4.75 (1H, br m), 4.60-4.49 (1H, br m).
61	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.28 (1H, dd, J = 4.8, 1.7 Hz), 7.42 (1H, dt, J = 7.5, 1.7 Hz), 7.33 (1H, d, J = 9.3 Hz), 7.10 (1H, dd, J = 7.5, 4.8 Hz), 6.77 (1H, d, J = 9.3 Hz), 6.69-6.62 (2H, m), 3.96-3.86 (2H, m), 1.16 (3H, t, J = 7.0 Hz).
62	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.30 (1H, dd, J = 4.8, 1.9 Hz), 7.56 (1H, s), 7.43 (1H, dt, J = 7.6, 1.9 Hz), 7.12 (1H, dd, J = 7.6, 4.8 Hz), 6.69-6.64 (2H, m), 4.03-3.89 (2H, m), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).
63	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.29 (1H, dd, J = 4.8, 1.9 Hz), 7.76 (1H, s), 7.43 (1H, dt, J = 7.6, 1.9 Hz), 7.12 (1H, dd, J = 7.6, 4.8 Hz), 6.69-6.64 (2H, m), 4.03-3.89 (2H, m), 1.19 (3H, t, J = 7.0 Hz).
64	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.28 (1H, dd, J = 4.9, 1.8 Hz), 7.81 (1H, s), 7.49-7.46 (1H, m), 7.41-7.35 (1H, m), 7.12 (1H, dd, J = 7.6, 4.9 Hz), 6.92-6.85 (2H, m), 4.88-4.77 (1H, br m), 4.60-4.49 (1H, br m).
65	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.24 (1H, dd, J = 4.9, 1.9 Hz), 8.00 (1H, s), 7.43 (1H, dt, J = 7.6, 1.9 Hz), 7.38-7.30 (1H, m), 7.06 (1H, dd, J = 7.6, 4.9 Hz), 6.91-6.85 (2H, m), 4.01-3.91 (2H, m), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
66	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.22 (1H, dd, J = 4.9, 2.0 Hz), 7.42 (1H, dt, J = 7.6, 2.0 Hz), 7.33-7.28 (1H, m), 7.23-7.22 (1H, m), 7.04 (1H, dd, J = 7.6, 4.9 Hz), 6.89-6.83 (2H, m), 3.92 (2H, q, J = 7.2 Hz), 2.27 (3H, d, J = 1.2 Hz), 1.16 (3H, t, J = 7.2 Hz).
67	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.30 (1H, dd, J = 4.9, 2.0 Hz), 7.44 (1H, dt, J = 7.5, 2.0 Hz), 7.39 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.13 (1H, dd, J = 7.6, 4.6 Hz), 6.80 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.68-6.63 (2H, m), 6.16 (1H, tt, J = 56.6, 4.4 Hz), 4.28-4.19 (1H, m), 4.14-4.05 (1H, m).
68	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.32 (1H, dd, J = 4.7, 2.0 Hz), 7.62 (1H, s), 7.46 (1H, dt, J = 7.6, 2.0 Hz), 7.15 (1H, dd, J = 7.6, 4.7 Hz), 6.70-6.63 (2H, m), 6.18 (1H, tt, J = 56.4, 4.4 Hz), 4.37-4.25 (1H, m), 4.16-4.06 (1H, m).
69	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.31 (1H, dd, J = 4.9, 2.0 Hz), 7.82 (1H, s), 7.46 (1H, dt, J = 7.6, 2.0 Hz), 7.15 (1H, dd, J = 7.6, 4.9 Hz), 6.70-6.62 (2H, m), 6.18 (1H, tt, J = 56.4, 4.5 Hz), 4.37-4.26 (1H, m), 4.16-4.05 (1H, m).
70	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.66 (1H, s), 7.41 (1H, s), 7.34 (1H, s), 6.76-6.74 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.20 (3H, t, J = 7.1 Hz).
71	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.86 (1H, s), 7.38 (1H, s), 7.31 (1H, s), 6.78-6.72 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz).

[表6-5]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
72	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.66 (1H, s), 7.43 (1H, s), 7.31 (1H, s), 6.50-6.49 (2H, m), 3.95 (2H, q, J = 7.0 Hz), 3.83 (3H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.0 Hz).
73	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.87 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.28 (1H, s), 6.51-6.48 (2H, m), 3.95 (2H, q, J = 7.2 Hz), 3.83 (3H, s), 1.18 (3H, t, J = 7.2 Hz).
74	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.72 (1H, s), 7.58 (1H, s), 7.48-7.42 (1H, m), 7.00-6.96 (2H, m), 3.97 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
75	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.72 (1H, s), 7.52-7.46 (1H, m), 7.04-6.99 (2H, m), 3.98 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz).
76	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.26 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.73-6.68 (3H, m), 3.88 (2H, q, J = 7.0 Hz), 2.08 (3H, s), 2.04 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.0 Hz).
77	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.86 (1H, s), 7.41 (1H, s), 7.34 (1H, s), 6.77-6.73 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz).
78	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.86 (1H, s), 7.43 (1H, s), 7.31 (1H, s), 6.50-6.48 (2H, m), 3.95 (2H, q, J = 7.2 Hz), 3.83 (3H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).
79	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.25 (1H, dd, J = 4.8, 1.8 Hz), 7.42 (1H, dt, J = 7.6, 1.8 Hz), 7.32 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.08 (1H, dd, J = 7.6, 4.8 Hz), 6.74 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.43-6.36 (2H, m), 3.93 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.76 (3H, s), 1.16 (3H, t, J = 7.1 Hz).
80	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.25 (1H, dd, J = 4.9, 1.8 Hz), 7.53 (1H, s), 7.41 (1H, dt, J = 7.6, 1.8 Hz), 7.08 (1H, dd, J = 7.6, 4.9 Hz), 6.40-6.34 (2H, m), 4.02-3.88 (2H, m), 3.74 (3H, s), 1.16 (3H, t, J = 7.1 Hz).
81	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.27 (1H, dd, J = 4.8, 1.9 Hz), 7.75 (1H, s), 7.43 (1H, dt, J = 7.6, 1.9 Hz), 7.10 (1H, dd, J = 7.6, 4.8 Hz), 6.42-6.37 (2H, m), 4.04-3.91 (2H, m), 3.76 (3H, s), 1.18 (3H, t, J = 7.0 Hz).
82	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.32 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.24 (1H, s), 6.73-6.68 (3H, m), 3.90 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.93 (3H, s), 1.18 (3H, t, J = 7.2 Hz).
83	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.57 (1H, s), 7.25 (1H, s), 6.73-6.67 (2H, m), 3.96 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.93 (3H, s), 1.20 (3H, t, J = 7.1 Hz).
84	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.71 (1H, s), 7.46 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.29 (1H, d, J = 2.4 Hz), 6.72-6.70 (2H, m), 6.20 (1H, dd, J = 2.4, 2.0 Hz), 3.95 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.20 (3H, t, J = 7.1 Hz).
85	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.68 (1H, s), 7.25 (1H, s), 7.04 (1H, s), 6.74-6.69 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.97 (3H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).
86	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.33 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.24 (1H, s), 7.03 (1H, s), 6.70-6.69 (2H, m), 3.88 (2H, q, J = 7.0 Hz), 2.24 (3H, d, J = 1.2 Hz), 1.97 (3H, s), 1.16 (3H, t, J = 7.0 Hz).
87	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.90 (1H, s), 7.64-7.57 (1H, m), 7.16-7.10 (2H, m), 5.96 (1H, s), 3.95 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz).
88	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.90 (1H, br s), 7.69 (1H, s), 7.44-7.36 (1H, m), 7.17 (1H, dd, J = 3.2, 2.0 Hz), 6.97-6.91 (2H, m), 6.42-6.41 (1H, m), 3.95 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.16 (4H, t, J = 7.1 Hz).
89	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.15 (1H, s), 7.77 (1H, s), 6.92-6.87 (2H, m), 6.19 (1H, s), 3.95 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).
90	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.18 (1H, s), 7.78 (1H, s), 6.65-6.61 (2H, m), 6.05 (1H, s), 3.98 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.89 (3H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz).
91	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.90 (1H, s), 7.51-7.44 (1H, m), 7.34 (1H, s), 7.03-6.97 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.78 (3H, s), 1.15 (3H, t, J = 7.1 Hz).
92	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.92 (1H, s), 7.63-7.57 (1H, m), 7.15-7.10 (2H, m), 5.96 (1H, s), 3.95 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.0 Hz).
93	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.31 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.72 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.69-6.66 (2H, m), 5.71 (1H, s), 3.89 (2H, q, J = 7.2 Hz), 2.07 (3H, s), 2.02 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.2 Hz).

[表6-6]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
94	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.30 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.69 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.44-6.42 (2H, m), 5.70 (1H, s), 3.91 (2H, q, J = 7.0 Hz), 3.80 (3H, s), 2.052 (3H, s), 2.048 (3H, s), 1.16 (3H, t, J = 7.0 Hz).
95	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.26 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.74-6.68 (3H, m), 3.89 (2H, q, J = 7.2 Hz), 2.07 (3H, s), 2.03 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.2 Hz).
96	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.93 (1H, s), 6.84-6.79 (2H, m), 3.97 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
97	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.94 (1H, s), 7.62 (1H, s), 6.80-6.75 (2H, m), 3.96 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
98	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.28 (1H, dd, J = 4.6, 1.9 Hz), 7.41 (1H, dt, J = 7.6, 1.9 Hz), 7.34 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.11 (1H, dd, J = 7.6, 4.6 Hz), 6.79 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.69-6.63 (2H, m), 3.39 (3H, s).
99	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.24 (1H, dd, J = 4.6, 1.9 Hz), 7.40 (1H, dt, J = 7.6, 1.9 Hz), 7.37-7.29 (2H, m), 7.06 (1H, dd, J = 7.6, 4.9 Hz), 6.91-6.82 (2H, m), 6.78 (1H, d, J = 9.3 Hz), 3.39 (3H, s).
100	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.31 (1H, dd, J = 4.8, 1.9 Hz), 7.58 (1H, s), 7.43 (1H, dt, J = 7.6, 1.9 Hz), 7.14 (1H, dd, J = 7.6, 4.8 Hz), 6.70-6.64 (2H, m), 3.46 (3H, s).
101	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.88 (1H, s), 7.25 (1H, s), 7.04 (1H, s), 6.73-6.70 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.97 (3H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz).
102	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.90 (1H, s), 6.55-6.51 (2H, m), 3.99 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.85 (3H, s), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
103	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.91 (1H, s), 7.62 (1H, s), 6.52-6.48 (2H, m), 3.99 (2H, q, J = 7.0 Hz), 3.83 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.0 Hz).
104	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.30 (1H, dd, J = 4.7, 1.9 Hz), 7.78 (1H, s), 7.43 (1H, dt, J = 7.7, 1.9 Hz), 7.13 (1H, dd, J = 7.7, 4.7 Hz), 6.70-6.63 (2H, m), 3.46 (3H, s).
105	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.26 (1H, dd, J = 4.9, 2.0 Hz), 7.59 (1H, s), 7.44-7.41 (1H, m), 7.39-7.32 (1H, m), 7.08 (1H, dd, J = 7.6, 4.9 Hz), 6.91-6.86 (2H, m), 3.46 (3H, s).
106	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.26 (1H, dd, J = 4.9, 1.9 Hz), 7.79 (1H, s), 7.42 (1H, dt, J = 7.5, 1.9 Hz), 7.39-7.31 (1H, m), 7.08 (1H, dd, J = 7.5, 4.9 Hz), 6.90-6.86 (2H, m), 3.46 (3H, s).
107	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.95 (1H, s), 7.61 (1H, s), 6.80-6.75 (2H, m), 3.96 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
108	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.40 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.23 (1H, s), 6.78-6.72 (3H, m), 3.87 (2H, q, J = 7.2 Hz), 2.12 (3H, s), 1.16 (3H, t, J = 7.2 Hz).
109	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.43 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.92 (1H, s), 6.73-6.70 (3H, m), 3.86 (2H, q, J = 7.1 Hz), 2.06 (3H, s), 1.87 (3H, s), 1.15 (3H, t, J = 7.1 Hz).
110	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.74 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.32 (1H, s), 6.77-6.75 (2H, m), 6.17 (1H, tt, J = 56.3, 4.6 Hz), 4.19 (2H, td, J = 12.6, 4.6 Hz).
111	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.75 (1H, s), 7.42 (1H, s), 7.27 (1H, s), 6.52-6.49 (2H, m), 6.17 (1H, tt, J = 56.5, 4.4 Hz), 4.21 (2H, td, J = 12.6, 4.4 Hz), 3.84 (3H, s).
112	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.75 (1H, s), 7.62 (1H, s), 6.81-6.75 (2H, m), 3.96 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
113	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.74 (1H, s), 7.62 (1H, s), 6.80-6.74 (2H, m), 3.96 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
114	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.70 (1H, s), 6.56-6.52 (2H, m), 3.99 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.85 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
115	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.72 (1H, s), 7.61 (1H, s), 6.53-6.48 (2H, m), 3.99 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.84 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
116	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.70 (1H, s), 6.56-6.51 (2H, m), 3.99 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.85 (3H, s), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).

[表6-7]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
117	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.71 (1H, s), 6.74-6.68 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.1 Hz), 2.09 (3H, s), 2.04 (3H, s), 1.20 (3H, t, J = 7.1 Hz).
118	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.71 (1H, s), 7.62 (1H, s), 6.52-6.48 (2H, m), 3.98 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.83 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
119	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.00 (1H, s), 7.79 (1H, s), 6.24 (2H, d, J = 10.0 Hz), 6.05 (1H, s), 4.42-4.38 (1H, m), 4.02 (2H, q, J = 7.1 Hz), 2.90 (3H, d, J = 5.1 Hz), 1.20 (3H, t, J = 7.1 Hz).
120	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.75 (1H, s), 7.47 (1H, d, J = 2.0 Hz), 6.85-6.78 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
121	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.71 (1H, s), 7.39 (1H, s), 7.33 (1H, s), 6.77-6.75 (2H, m), 4.63-4.61 (2H, br m).
122	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.72 (1H, s), 7.42 (1H, s), 7.27 (1H, s), 6.51-6.49 (2H, m), 4.66-4.64 (2H, br m), 3.84 (3H, s).
123	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 9.81 (1H, s), 7.90 (1H, s), 7.85 (1H, s), 7.70 (1H, s), 6.75-6.74 (2H, m), 3.95 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.21 (3H, t, J = 7.2 Hz).
124	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.69 (1H, s), 7.58 (1H, s), 7.50 (1H, s), 6.76-6.47 (3H, m), 3.95 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.20 (3H, t, J = 7.2 Hz).
125	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.45 (1H, s), 6.73-6.71 (2H, m), 5.68 (2H, s), 3.96 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.96 (6H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).
126	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.43 (1H, s), 6.47-6.45 (2H, m), 5.68 (2H, s), 3.98 (2H, q, J = 7.2 Hz), 3.79 (3H, s), 1.96 (6H, s), 1.18 (3H, t, J = 7.2 Hz).
127	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.73 (1H, s), 7.47 (1H, d, J = 1.8 Hz), 6.56-6.52 (2H, m), 3.97 (2H, q, J = 7.0 Hz), 3.86 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.0 Hz).
128	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.83 (1H, s), 7.81 (1H, s), 7.68 (1H, s), 6.75-6.73 (2H, m), 3.95 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.81 (3H, s), 1.20 (3H, t, J = 7.1 Hz).
129	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.63 (1H, s), 7.61 (1H, s), 7.41 (1H, s), 6.76-6.74 (1H, m), 6.69-6.67 (1H, m), 4.29-4.19 (2H, m), 3.91 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.26 (3H, t, J = 7.2 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).
130	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.88 (1H, s), 7.60-7.54 (1H, m), 7.13-7.09 (2H, m), 5.67 (1H, s), 3.99 (3H, s), 3.93 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
131	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.83 (1H, s), 7.57-7.50 (1H, m), 7.12-7.06 (2H, m), 5.81 (1H, s), 3.92 (2H, q, J = 7.1 Hz), 2.95 (6H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
132	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.63 (1H, s), 6.71-6.69 (2H, m), 6.49 (2H, t, J = 2.1 Hz), 6.05 (2H, t, J = 2.1 Hz), 3.92 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).
133	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.48 (1H, s), 6.73-6.72 (2H, m), 5.95 (2H, s), 4.00 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.0 Hz).
134	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.85 (1H, s), 7.59-7.52 (1H, m), 7.13-7.07 (2H, m), 5.67 (1H, s), 4.51-4.47 (1H, m), 3.93 (2H, q, J = 7.1 Hz), 2.90 (3H, d, J = 5.1 Hz), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
135	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.86 (1H, s), 7.61-7.52 (1H, m), 7.13-7.08 (2H, m), 5.59 (1H, s), 4.61 (2H, br s), 3.93 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
136	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.28-7.26 (2H, m), 7.24 (1H, s), 6.79-6.78 (3H, m), 3.96-3.94 (1H, m), 3.82-3.80 (1H, m), 1.17 (3H, t, J = 7.2 Hz).
137	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.47 (1H, s), 6.81-6.80 (2H, m), 4.01-3.94 (2H, m), 1.20 (3H, t, J = 7.0 Hz).
138	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.54 (1H, s), 7.25 (1H, s), 6.80-6.78 (2H, m), 4.03-4.01 (1H, m), 3.88-3.86 (1H, m), 1.20 (3H, t, J = 7.0 Hz).
139	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.74 (1H, s), 7.25 (1H, s), 6.80-6.78 (2H, m), 4.03-4.01 (1H, m), 3.88-3.85 (1H, m), 1.20 (3H, t, J = 7.1 Hz).
140	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.08 (1H, s), 7.37 (1H, s), 7.31 (1H, s), 6.75-6.73 (2H, m), 3.93 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.2 Hz).

[表6-8]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
141	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.40 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.20 (1H, s), 6.76-6.73 (3H, m), 3.86 (2H, q, J = 7.2 Hz), 2.12 (3H, s), 1.16 (3H, t, J = 7.2 Hz).
142	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.66 (1H, s), 7.20 (1H, s), 6.77-6.76 (2H, m), 3.93 (2H, q, J = 7.2 Hz), 2.12 (3H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).
143	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.68 (1H, s), 7.15 (1H, s), 6.52-6.50 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.2 Hz), 3.84 (3H, s), 2.15 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.2 Hz).
144	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.86 (1H, s), 7.20 (1H, s), 6.77-6.75 (2H, m), 3.92 (2H, q, J = 7.0 Hz), 2.12 (3H, s), 1.18 (3H, t, J = 7.0 Hz).
145	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.40 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.36 (1H, s), 7.20 (1H, s), 7.17-7.14 (1H, m), 6.92-6.89 (2H, m), 6.71 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.03-3.98 (1H, m), 3.73-3.69 (1H, m), 1.14 (3H, t, J = 7.1 Hz).
146	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.88 (1H, s), 7.15 (1H, s), 6.52-6.50 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.2 Hz), 3.84 (3H, s), 2.15 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.2 Hz).
147	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.86 (1H, s), 7.22 (1H, s), 6.78-6.74 (2H, m), 3.92 (2H, q, J = 7.1 Hz), 2.12 (3H, s), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
148	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.66 (1H, s), 7.38 (1H, s), 7.19 (1H, s), 7.16-7.14 (1H, m), 6.95-6.88 (2H, m), 4.11-4.02 (1H, m), 3.79-3.76 (1H, m), 1.16 (3H, t, J = 7.1 Hz).
149	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.67 (1H, s), 7.39 (1H, s), 7.16 (1H, s), 7.05-7.01 (1H, m), 6.70-6.67 (2H, m), 4.09-4.06 (1H, m), 3.83-3.78 (4H, m), 1.15 (3H, t, J = 7.2 Hz).
150	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.86 (1H, s), 7.38 (1H, s), 7.20 (1H, s), 7.19-7.14 (1H, m), 6.95-6.89 (2H, m), 4.07-4.04 (1H, m), 3.79-3.76 (1H, m), 1.16 (3H, t, J = 7.0 Hz).
151	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.87 (1H, s), 7.18 (1H, s), 6.52-6.49 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.2 Hz), 3.84 (3H, s), 2.15 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.2 Hz).
152	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.87 (1H, s), 7.39 (1H, s), 7.16 (1H, s), 7.03-7.01 (1H, m), 6.69-6.67 (2H, m), 4.11-4.05 (1H, m), 3.82-3.79 (4H, m), 1.15 (3H, t, J = 7.1 Hz).
153	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.41-7.38 (1H, m), 7.33 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.20 (1H, s), 6.92-6.90 (2H, m), 6.73 (1H, d, J = 9.8 Hz), 3.91 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.91 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.2 Hz).
154	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.86 (1H, s), 7.66 (1H, s), 7.64 (1H, s), 6.78-6.77 (2H, m), 3.95 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.22 (3H, t, J = 7.0 Hz).
155	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.70 (1H, s), 7.64 (1H, s), 7.61 (1H, s), 6.76-6.74 (2H, m), 3.95 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.22 (3H, t, J = 7.1 Hz).
156	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.42 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.37 (1H, s), 7.27-7.24 (1H, m), 7.23-7.21 (2H, m), 7.03-6.99 (1H, m), 6.71 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.27-4.20 (1H, m), 3.46-3.38 (1H, m), 1.12 (3H, t, J = 7.0 Hz).
157	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.67 (1H, s), 7.38 (1H, s), 7.26-7.22 (2H, m), 7.21 (1H, s), 7.05-7.00 (1H, m), 4.30-4.25 (1H, m), 3.53-3.46 (1H, m), 1.14 (3H, t, J = 7.0 Hz).
158	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.87 (1H, s), 7.38 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.26-7.22 (2H, m), 7.21 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.04-7.00 (1H, m), 4.30-4.23 (1H, m), 3.53-3.46 (1H, m), 1.14 (3H, t, J = 7.0 Hz).
159	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.69 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.18 (1H, s), 7.11 (1H, d, J = 8.6 Hz), 6.99 (1H, d, J = 2.7 Hz), 6.80 (1H, dd, J = 8.6, 2.7 Hz), 4.31-4.24 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.57-3.50 (1H, m), 1.13 (3H, t, J = 7.0 Hz).
160	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.65 (1H, s), 7.45 (1H, s), 7.36 (1H, s), 6.75-6.73 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).
161	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.07 (1H, s), 8.00 (1H, s), 7.69 (1H, s), 6.79-6.77 (2H, m), 3.95 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.21 (3H, t, J = 7.0 Hz).

[表6-9]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
162	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.25 (1H, s), 7.57-7.51 (1H, m), 7.10-7.05 (2H, m), 5.99 (1H, s), 3.94 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.72 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
163	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.65 (1H, s), 7.45 (1H, s), 7.36 (1H, s), 6.75-6.73 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).
164	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.43-7.37 (3H, m), 7.28-7.27 (1H, m), 7.25 (1H, d, J = 0.7 Hz), 7.08-7.04 (1H, m), 6.71 (1H, d, J = 9.5 Hz), 4.32-4.24 (1H, m), 3.41-3.33 (1H, m), 1.12 (3H, t, J = 7.1 Hz).
165	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.67 (1H, s), 7.42-7.37 (2H, m), 7.28-7.24 (4H, m), 7.10-7.05 (1H, m), 4.37-4.28 (1H, m), 3.49-3.40 (1H, m), 1.14 (3H, t, J = 7.1 Hz).
166	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.87 (1H, s), 7.41-7.37 (2H, m), 7.28-7.24 (2H, m), 7.10-7.04 (1H, m), 4.36-4.28 (1H, m), 3.49-3.41 (1H, m), 1.14 (3H, t, J = 7.0 Hz).
167	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.69 (1H, s), 7.40 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.22 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.16 (1H, d, J = 2.4 Hz), 7.13 (1H, d, J = 8.6 Hz), 6.85 (1H, dd, J = 8.6, 2.4 Hz), 4.36-4.29 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.53-3.46 (1H, m), 1.13 (3H, t, J = 7.0 Hz).
168	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.45 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.36 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.17-7.13 (1H, m), 7.01 (1H, d, J = 0.6 Hz), 6.97-6.91 (2H, m), 6.68 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.21-4.11 (1H, m), 3.48-3.39 (1H, m), 2.13 (3H, s), 1.10 (3H, t, J = 7.1 Hz).
169	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.47-7.43 (2H, m), 7.39 (1H, td, J = 7.7, 1.8 Hz), 7.36 (1H, s), 7.29 (1H, dd, J = 7.7, 1.3 Hz), 7.23 (1H, dd, J = 7.7, 1.8 Hz), 7.18 (1H, s), 6.71 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.28-4.19 (1H, m), 3.48-3.40 (1H, m), 1.11 (3H, t, J = 7.0 Hz).
170	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.72 (1H, s), 7.37 (1H, d, J = 0.7 Hz), 7.17-7.12 (1H, m), 7.00 (1H, d, J = 0.7 Hz), 6.97-6.93 (2H, m), 4.27-4.17 (1H, m), 3.55-3.47 (1H, m), 2.12 (3H, s), 1.13 (3H, t, J = 7.1 Hz).
171	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.91 (1H, s), 7.37 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.17-7.12 (1H, m), 7.00 (1H, d, J = 0.6 Hz), 6.97-6.93 (2H, m), 4.26-4.17 (1H, m), 3.55-3.46 (1H, m), 2.13 (3H, s), 1.12 (3H, t, J = 7.1 Hz).
172	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.70 (1H, s), 7.48 (1H, dd, J = 8.0, 1.0 Hz), 7.42 (1H, td, J = 7.5, 1.8 Hz), 7.37 (1H, d, J = 0.7 Hz), 7.30 (1H, td, J = 7.5, 1.0 Hz), 7.22 (1H, dd, J = 7.5, 1.8 Hz), 7.17 (1H, d, J = 0.7 Hz), 4.32-4.25 (1H, m), 3.54-3.48 (1H, m), 1.14 (3H, t, J = 7.0 Hz).
173	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.90 (1H, s), 7.48 (1H, dd, J = 8.0, 1.5 Hz), 7.42 (1H, td, J = 7.6, 1.5 Hz), 7.37 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.29 (1H, td, J = 7.6, 1.2 Hz), 7.23 (1H, dd, J = 7.6, 1.2 Hz), 7.17 (1H, d, J = 0.6 Hz), 4.31-4.24 (1H, m), 3.55-3.48 (1H, m), 1.14 (3H, t, J = 7.0 Hz).
174	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.43 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.38 (1H, s), 7.31 (1H, s), 6.76-6.74 (3H, m), 3.38 (3H, s).
175	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.69 (1H, s), 7.39 (1H, s), 7.31 (1H, s), 6.79-6.74 (2H, m), 3.45 (3H, s).
176	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.72 (1H, s), 7.25-7.24 (3H, m), 7.04-7.02 (2H, m), 3.95-3.93 (2H, br m), 1.86 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.0 Hz).
177	¹ H-NMR (DMSO-D ₆) δ: 8.15 (1H, s), 8.09 (1H, s), 7.58 (1H, s), 6.89-6.86 (2H, m), 3.80 (3H, s), 3.34 (3H, s).
178	¹ H-NMR (DMSO-D ₆) δ: 8.29 (1H, s), 8.09 (1H, s), 7.58 (1H, s), 6.89-6.87 (2H, m), 3.80 (3H, s), 3.34 (3H, s).
179	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.54 (1H, s), 7.40 (1H, dd, J = 8.2, 1.3 Hz), 7.36-7.30 (2H, m), 7.24-7.22 (1H, m), 7.20 (1H, s), 4.36-4.32 (1H, m), 3.55-3.50 (1H, m), 1.87 (3H, s), 1.15 (3H, t, J = 7.1 Hz).

[表6-10]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
180	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.92 (1H, s), 7.46-7.44 (1H, m), 7.39-7.37 (1H, m), 7.26-7.24 (3H, m), 6.91 (1H, s), 4.31-4.28 (1H, m), 3.52-3.49 (1H, m), 1.88 (3H, s), 1.13 (3H, t, J = 7.0 Hz).
181	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.74 (1H, s), 7.40-7.39 (1H, m), 7.35-7.30 (2H, m), 7.24-7.23 (1H, m), 7.21 (1H, s), 4.35-4.32 (1H, m), 3.54-3.52 (1H, m), 1.87 (3H, s), 1.14 (3H, t, J = 7.2 Hz).
182	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.55 (1H, s), 7.26 (1H, s), 7.19-7.18 (1H, m), 6.87-6.84 (2H, m), 4.16-4.14 (1H, m), 3.76-3.73 (1H, m), 1.89 (3H, s), 1.16 (3H, t, J = 7.2 Hz).
183	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.64 (1H, dd, J = 7.0, 2.1 Hz), 7.44 (1H, d, J = 9.6 Hz), 7.36 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.35-7.29 (2H, m), 7.26-7.24 (1H, m), 7.22 (1H, d, J = 0.6 Hz), 6.71 (1H, d, J = 9.6 Hz), 4.32-4.25 (1H, m), 3.43-3.36 (1H, m), 1.12 (3H, t, J = 7.0 Hz).
184	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.70 (1H, s), 7.42 (1H, s), 7.28 (1H, br s), 7.13 (1H, br s), 6.50-6.48 (2H, m), 3.98 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.20 (3H, t, J = 7.1 Hz).
185	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.84 (1H, d, J = 9.3 Hz), 7.39 (1H, s), 7.33 (1H, s), 7.20 (1H, d, J = 9.3 Hz), 6.78-6.76 (2H, m), 4.52 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.27 (3H, t, J = 7.1 Hz).
186	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.54 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.47-7.40 (1H, m), 7.24 (1H, s), 7.01 (1H, s), 6.96-6.94 (2H, m), 6.76 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.15 (1H, tt, J = 56.6, 4.6 Hz), 4.14 (2H, td, J = 12.8, 4.6 Hz), 1.94 (3H, s).
187	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.60 (1H, s), 7.41-7.39 (1H, m), 7.24 (1H, s), 6.94-6.92 (2H, m), 3.47 (3H, s), 1.91 (3H, s).
188	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.94 (1H, s), 7.44-7.42 (1H, m), 7.26 (1H, s), 6.99 (1H, s), 6.97-6.95 (2H, m), 3.45 (3H, s), 1.94 (3H, s).
189	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.79 (1H, s), 7.41-7.39 (1H, m), 7.24 (1H, s), 6.94-6.92 (2H, m), 3.47 (3H, s), 1.91 (3H, s).
190	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.65 (1H, s), 7.44-7.40 (1H, m), 7.24 (1H, s), 6.94-6.92 (2H, m), 6.17 (1H, tt, J = 56.3, 4.5 Hz), 4.23 (2H, td, J = 12.6, 4.5 Hz), 1.92 (3H, s).
191	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.42 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.31-7.30 (1H, m), 7.21-7.20 (1H, m), 6.75-6.73 (3H, m), 3.87 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.17 (3H, t, J = 7.0 Hz).
192	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.68 (1H, s), 7.33-7.32 (1H, m), 7.22-7.21 (1H, m), 6.76-6.74 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).
193	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.85 (1H, s), 7.47-7.40 (1H, m), 7.24 (1H, s), 6.94-6.92 (2H, m), 6.17 (1H, tt, J = 56.3, 4.5 Hz), 4.23 (2H, td, J = 12.6, 4.5 Hz), 1.91 (3H, s).
194	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.88 (1H, s), 7.324-7.315 (1H, m), 7.22-7.21 (1H, m), 6.77-6.73 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).
195	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.70 (1H, s), 7.66-7.64 (1H, m), 7.37 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.36-7.33 (2H, m), 7.25-7.23 (1H, m), 7.21 (1H, d, J = 0.6 Hz), 4.37-4.30 (1H, m), 3.50-3.43 (1H, m), 1.14 (3H, t, J = 7.2 Hz).
196	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.90 (1H, s), 7.67-7.63 (1H, m), 7.37 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.36-7.32 (2H, m), 7.25-7.23 (1H, m), 7.21 (1H, d, J = 0.6 Hz), 4.36-4.29 (1H, m), 3.51-3.44 (1H, m), 1.14 (3H, t, J = 7.0 Hz).
197	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.44 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.42-7.38 (1H, m), 7.36 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.29 (1H, s), 7.27-7.25 (1H, m), 7.09 (1H, td, J = 8.4, 0.9 Hz), 6.75 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.13-4.05 (1H, m), 3.64-3.57 (1H, m), 1.17 (3H, t, J = 7.0 Hz).
198	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.70 (1H, s), 7.44-7.40 (1H, m), 7.37 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.28-7.27 (2H, m), 7.10 (1H, td, J = 8.4, 0.9 Hz), 4.18-4.11 (1H, m), 3.71-3.64 (1H, m), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).

[表6-11]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
199	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.90 (1H, s), 7.44-7.40 (1H, m), 7.37 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.28-7.26 (2H, m), 7.10 (1H, td, J = 8.4, 0.9 Hz), 4.17-4.10 (1H, m), 3.71-3.64 (1H, m), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).
200	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.67 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.27 (1H, s), 6.48-6.46 (2H, m), 4.02 (2H, q, J = 7.0 Hz), 3.95 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.44 (3H, t, J = 7.0 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.0 Hz).
201	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.67 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.28 (1H, s), 6.60-6.59 (2H, m), 4.71 (2H, d, J = 2.1 Hz), 3.96 (2H, q, J = 7.1 Hz), 2.62 (1H, t, J = 2.1 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz).
202	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.67 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.27 (1H, s), 6.52-6.50 (2H, m), 6.00 (1H, ddt, J = 17.4, 10.5, 5.3 Hz), 5.42 (1H, dq, J = 17.4, 1.5 Hz), 5.36 (1H, dq, J = 10.5, 1.0 Hz), 4.53 (2H, dt, J = 5.3, 1.5 Hz), 3.95 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.0 Hz).
203	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.67 (1H, s), 7.41 (1H, s), 7.27 (1H, s), 6.66-6.64 (2H, m), 5.17 (2H, s), 3.96 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.49 (3H, s), 1.20 (3H, t, J = 7.1 Hz).
204	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.67 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.28 (1H, s), 6.54-6.52 (2H, m), 4.11-4.10 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.76-3.75 (2H, m), 3.45 (3H, s), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
205	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.67 (1H, s), 7.39 (1H, s), 7.30 (1H, s), 6.87-6.81 (2H, m), 3.96 (2H, q, J = 7.1 Hz), 2.32 (3H, s), 1.20 (3H, t, J = 7.1 Hz).
206	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.37 (1H, s), 7.31 (1H, q, J = 0.9 Hz), 7.30 (1H, s), 6.75-6.71 (2H, m), 3.88 (2H, q, J = 7.1 Hz), 2.25 (3H, d, J = 0.9 Hz), 1.16 (3H, t, J = 7.1 Hz).
207	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.94 (1H, s), 7.39 (1H, s), 7.32 (1H, s), 6.77-6.75 (2H, m), 6.17 (1H, tt, J = 56.4, 4.5 Hz), 4.18 (2H, td, J = 12.6, 4.5 Hz).
208	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.47-7.45 (1H, m), 7.41 (1H, td, J = 7.7, 1.6 Hz), 7.31-7.28 (3H, m), 7.20-7.18 (1H, br m), 6.73 (1H, d, J = 9.5 Hz), 4.19-4.17 (1H, br m), 3.47-3.45 (1H, br m), 1.15 (3H, t, J = 7.0 Hz).
209	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.53 (1H, s), 7.48-7.47 (1H, m), 7.43 (1H, td, J = 7.7, 1.6 Hz), 7.35-7.20 (3H, m), 4.24-4.23 (1H, br m), 3.55-3.53 (1H, br m), 1.18 (3H, t, J = 7.0 Hz).
210	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.73 (1H, s), 7.46-7.43 (2H, m), 7.35-7.20 (3H, m), 4.24-4.21 (1H, br m), 3.56-3.53 (1H, br m), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
211	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.50 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.39 (1H, s), 7.18-7.15 (2H, m), 6.94-6.90 (2H, m), 6.75 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.19 (1H, tdd, J = 56.7, 5.9, 3.3 Hz), 4.43-4.34 (1H, m), 3.86-3.81 (1H, m).
212	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.75 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.18-7.16 (2H, m), 6.94-6.93 (2H, m), 6.21 (1H, tdd, J = 56.6, 5.9, 3.3 Hz), 4.48-4.39 (1H, m), 3.91-3.86 (1H, m).
213	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.76 (1H, s), 7.42 (1H, s), 7.14 (1H, s), 7.04-7.02 (1H, m), 6.71-6.68 (2H, m), 6.21 (1H, tdd, J = 56.8, 5.9, 3.4 Hz), 4.46-4.40 (1H, m), 3.98-3.92 (1H, m), 3.84 (3H, s).
214	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.95 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.19-7.15 (2H, m), 6.94-6.92 (2H, m), 6.21 (1H, tdd, J = 56.6, 5.9, 3.3 Hz), 4.46-4.40 (1H, m), 3.91-3.87 (1H, m).
215	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.96 (1H, s), 7.41 (1H, s), 7.14 (1H, s), 7.05-7.03 (1H, m), 6.71-6.67 (2H, m), 6.21 (1H, tdd, J = 56.7, 5.8, 3.4 Hz), 4.45-4.39 (1H, m), 4.02-3.91 (1H, m), 3.84 (3H, s).
216	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.45-7.41 (2H, m), 7.36 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.35-7.32 (1H, m), 7.31 (1H, s), 7.14 (1H, td, J = 8.5, 1.0 Hz), 6.75 (1H, d, J = 9.5 Hz), 4.17-4.10 (1H, m), 3.59-3.52 (1H, m), 1.18 (3H, t, J = 7.0 Hz).
217	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.47-7.41 (2H, m), 7.36-7.35 (1H, br m), 7.18-7.13 (4H, m), 6.70 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.06-3.97 (1H, m), 3.77-3.68 (1H, m), 1.13 (3H, t, J = 7.1 Hz).

[表6-12]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
218	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.70 (1H, s), 7.45-7.42 (1H, m), 7.38-7.32 (2H, m), 7.30 (1H, s), 7.15 (1H, td, J = 8.4, 1.1 Hz), 4.23-4.10 (1H, m), 3.67-3.58 (1H, m), 1.20 (3H, t, J = 7.1 Hz).
219	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.90 (1H, s), 7.44-7.42 (1H, m), 7.37 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.36-7.33 (1H, m), 7.30 (1H, s), 7.14 (1H, td, J = 8.3, 0.9 Hz), 4.21-4.15 (1H, m), 3.66-3.59 (1H, m), 1.20 (3H, t, J = 7.0 Hz).
220	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.69 (1H, s), 7.49-7.44 (1H, m), 7.37 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.19-7.14 (4H, m), 4.09-4.01 (1H, m), 3.83-3.76 (1H, m), 1.16 (3H, t, J = 7.0 Hz).
221	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.89 (1H, s), 7.49-7.44 (1H, m), 7.37 (1H, s), 7.19-7.13 (4H, m), 4.10-4.03 (1H, m), 3.83-3.76 (1H, m), 1.16 (3H, t, J = 7.2 Hz).
222	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.95 (1H, s), 7.42 (1H, s), 7.28 (1H, s), 6.51-6.49 (2H, m), 6.17 (1H, tt, J = 56.5, 4.5 Hz), 4.21 (2H, td, J = 12.6, 4.5 Hz), 3.84 (3H, s).
223	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.66 (1H, s), 7.37 (1H, s), 7.32 (1H, s), 6.75-6.74 (2H, m), 3.91 (2H, q, J = 7.0 Hz), 3.45 (1H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.0 Hz).
224	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.67 (1H, s), 7.39 (1H, s), 7.29 (1H, s), 6.50-6.48 (2H, m), 3.92 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.82 (2H, s), 3.43 (1H, s), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
225	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.40 (1H, s), 7.32 (1H, s), 6.75-6.71 (3H, m), 3.91 (2H, q, J = 7.0 Hz), 3.89 (3H, s), 1.16 (3H, t, J = 7.0 Hz).
226	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.88 (1H, s), 7.25 (1H, s), 7.17-7.15 (1H, m), 6.92-6.85 (3H, m), 4.09-4.06 (1H, m), 3.78-3.75 (1H, m), 1.93 (3H, s), 1.15 (3H, t, J = 7.2 Hz).
227	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.57 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.46 (1H, dd, J = 8.2, 0.9 Hz), 7.38 (1H, ddd, J = 8.6, 6.8, 1.3 Hz), 7.26-7.21 (3H, m), 6.86 (1H, s), 6.73 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.35-6.04 (1H, m), 4.62-4.50 (1H, m), 3.62-3.57 (1H, m).
228	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.75 (1H, s), 7.26 (1H, s), 7.19-7.18 (1H, br m), 6.87-6.84 (2H, m), 4.16-4.14 (1H, br m), 3.76-3.74 (1H, br m), 1.89 (3H, s), 1.16 (3H, t, J = 7.0 Hz).
229	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.62 (1H, s), 7.42-7.41 (1H, m), 7.37-7.35 (1H, m), 7.26-7.22 (3H, m), 6.29-6.13 (1H, m), 4.71-4.61 (1H, m), 3.73-3.65 (1H, m), 1.88 (3H, s).
230	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.82 (1H, s), 7.42-7.41 (1H, m), 7.38-7.33 (1H, m), 7.26-7.23 (3H, m), 6.28-6.14 (1H, m), 4.67-4.62 (1H, m), 3.72-3.67 (1H, m), 1.88 (3H, s).
231	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.46-7.43 (2H, m), 7.36-7.32 (2H, m), 7.21-7.19 (2H, m), 6.77 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.37-6.06 (1H, m), 4.60-4.49 (1H, m), 3.59-3.57 (1H, br m).
232	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.61 (1H, s), 7.47-7.45 (2H, m), 7.36-7.34 (1H, m), 7.22-7.20 (2H, m), 6.31-6.16 (1H, m), 4.63-4.56 (1H, m), 3.66-3.64 (1H, br m).
233	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.52 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.39 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.25-7.20 (2H, m), 7.17 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.05-7.00 (1H, m), 6.75 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.32-6.06 (1H, m), 4.61-4.51 (1H, m), 3.60-3.51 (1H, m).
234	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.77 (1H, s), 7.40 (1H, d, J = 0.7 Hz), 7.26-7.20 (2H, m), 7.16 (1H, d, J = 0.7 Hz), 7.06-7.01 (1H, m), 6.37-6.05 (1H, m), 4.67-4.54 (1H, m), 3.67-3.57 (1H, m).
235	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.96 (1H, s), 7.40 (1H, d, J = 0.7 Hz), 7.25-7.20 (2H, m), 7.16 (1H, d, J = 0.7 Hz), 7.06-7.01 (1H, m), 6.37-6.05 (1H, m), 4.65-4.53 (1H, m), 3.68-3.57 (1H, m).

[表6-13]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
236	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.81 (1H, s), 7.48-7.44 (2H, m), 7.35-7.33 (1H, m), 7.22-7.20 (2H, m), 6.39-6.08 (1H, m), 4.64-4.53 (1H, m), 3.66-3.64 (1H, br m).
237	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.98 (1H, s), 7.33 (1H, td, J = 7.5, 1.6 Hz), 7.23-7.18 (4H, m), 6.67 (1H, s), 4.24-4.19 (1H, m), 3.57-3.52 (1H, m), 2.10 (3H, s), 1.86 (3H, s), 1.12 (3H, t, J = 7.0 Hz).
238	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.41 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.39 (1H, s), 7.28 (1H, s), 6.72 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.50-6.48 (2H, m), 3.89 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.82 (3H, s), 1.16 (3H, t, J = 7.1 Hz).
239	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.78 (1H, s), 7.42 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.12 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.09 (1H, dd, J = 8.6, 2.0 Hz), 7.00 (1H, d, J = 2.5 Hz), 6.81 (1H, dd, J = 8.6, 2.5 Hz), 6.37-6.06 (1H, m), 4.63-4.52 (1H, m), 3.85 (3H, s), 3.73-3.67 (1H, m).
240	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.98 (1H, s), 7.42 (1H, d, J = 0.7 Hz), 7.13 (1H, d, J = 0.7 Hz), 7.09 (1H, dd, J = 8.7, 2.1 Hz), 7.00 (1H, d, J = 2.4 Hz), 6.81 (1H, dd, J = 8.7, 2.4 Hz), 6.37-6.06 (1H, m), 4.62-4.51 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.76-3.65 (1H, m).
241	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.90 (1H, s), 7.44-7.40 (1H, m), 7.36 (1H, s), 7.04-7.01 (2H, m), 6.96-6.91 (2H, m), 4.16-4.09 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.69-3.60 (1H, m), 1.11 (3H, t, J = 7.3 Hz).
242	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.45 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.42-7.38 (1H, m), 7.35 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.04-7.02 (2H, m), 6.95-6.90 (2H, m), 6.66 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.12-4.04 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.61-3.53 (1H, m), 1.09 (3H, t, J = 7.0 Hz).
243	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.71 (1H, s), 7.44-7.40 (1H, m), 7.37 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.04-7.01 (2H, m), 6.96-6.92 (2H, m), 4.17-4.09 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.68-3.60 (1H, m), 1.11 (3H, t, J = 7.0 Hz).
244	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.53 (1H, s), 7.29-7.25 (1H, m), 7.19-7.12 (4H, m), 4.29-4.26 (1H, m), 3.48-3.43 (1H, m), 2.21 (3H, s), 1.86 (3H, s), 1.13 (3H, t, J = 7.1 Hz).
245	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.72 (1H, s), 7.29-7.25 (1H, m), 7.17-7.14 (4H, m), 4.27-4.25 (1H, m), 3.48-3.43 (1H, m), 2.21 (3H, s), 1.86 (3H, s), 1.12 (3H, t, J = 7.0 Hz).
246	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.47 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.38-7.36 (1H, m), 7.23 (1H, s), 7.03 (1H, dd, J = 7.5, 1.7 Hz), 6.91-6.88 (2H, m), 6.77 (1H, s), 6.65 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.13-4.10 (1H, m), 3.83 (3H, s), 3.57-3.54 (1H, m), 1.86 (3H, s), 1.08 (3H, t, J = 7.2 Hz).
247	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.93 (1H, s), 7.39-7.38 (1H, m), 7.24 (1H, s), 7.03 (1H, dd, J = 7.5, 1.7 Hz), 6.93-6.88 (2H, m), 6.75 (1H, s), 4.17-4.14 (1H, m), 3.83 (3H, s), 3.64-3.61 (1H, m), 1.86 (3H, s), 1.10 (3H, t, J = 7.0 Hz).
248	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.53 (1H, s), 7.34-7.32 (1H, m), 7.20 (1H, s), 7.11-7.09 (1H, br m), 6.87-6.84 (2H, m), 4.23-4.22 (1H, br m), 3.78 (3H, s), 3.66-3.61 (1H, m), 1.85 (3H, s), 1.12 (3H, t, J = 7.0 Hz).
249	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.72 (1H, s), 7.35-7.32 (1H, m), 7.20 (1H, s), 7.12-7.10 (1H, br m), 6.87-6.84 (2H, m), 4.23-4.21 (1H, br m), 3.78 (3H, s), 3.66-3.63 (1H, m), 1.85 (3H, s), 1.12 (3H, t, J = 7.0 Hz).
250	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.42 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.31-7.30 (1H, m), 7.19-7.14 (1H, m), 7.10-7.09 (1H, m), 6.94-6.88 (2H, m), 6.71 (1H, d, J = 9.5 Hz), 4.02-4.00 (1H, m), 3.72-3.69 (1H, m), 1.13 (3H, t, J = 7.2 Hz).
251	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.68 (1H, s), 7.32 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.18-7.14 (1H, m), 7.09 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.95-6.88 (2H, m), 4.08-4.05 (1H, m), 3.79-3.76 (1H, m), 1.16 (3H, t, J = 7.1 Hz).

[表6-14]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
252	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.88 (1H, s), 7.31 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.19-7.14 (1H, m), 7.09 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.95-6.89 (2H, m), 4.07-4.05 (1H, m), 3.79-3.76 (1H, m), 1.16 (3H, t, J = 7.0 Hz).
253	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.08 (1H, s), 7.37 (1H, s), 7.29 (1H, s), 6.48 (1H, dd, J = 10.5, 1.7 Hz), 3.95-3.85 (5H, m), 1.17 (3H, t, J = 7.0 Hz).
254	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.52 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.26 (1H, s), 7.18-7.14 (1H, m), 6.91-6.86 (3H, m), 6.77 (1H, s), 6.73 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.34-6.03 (1H, m), 4.42-4.36 (1H, m), 3.83-3.81 (1H, br m), 1.93 (3H, s).
255	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.63 (1H, s), 7.28 (1H, s), 7.19-7.17 (1H, m), 6.88-6.85 (2H, m), 6.32-6.07 (1H, m), 4.57-4.54 (1H, m), 3.89-3.81 (1H, m), 1.89 (3H, s).
256	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.82 (1H, s), 7.28 (1H, s), 7.20-7.16 (1H, m), 6.88-6.85 (2H, m), 6.35-6.04 (1H, m), 4.61-4.51 (1H, m), 3.87-3.84 (1H, m), 1.89 (3H, s).
257	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.22-8.20 (1H, m), 7.81 (1H, s), 7.71-7.64 (2H, m), 7.37-7.35 (1H, m), 7.25 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.17 (1H, d, J = 0.6 Hz), 4.22-4.14 (1H, m), 3.53-3.45 (1H, m), 1.16 (3H, t, J = 7.2 Hz).
258	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.22-8.20 (1H, m), 7.71-7.64 (2H, m), 7.61 (1H, s), 7.37-7.35 (1H, m), 7.25 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.17 (1H, d, J = 0.6 Hz), 4.22-4.15 (1H, m), 3.52-3.45 (1H, m), 1.17 (3H, t, J = 7.0 Hz).
259	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.45 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.43-7.38 (1H, m), 7.23 (1H, s), 7.17-7.10 (3H, m), 6.90 (1H, s), 6.69 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.05-4.02 (1H, m), 3.72-3.70 (1H, m), 1.89 (3H, s), 1.13 (3H, t, J = 7.0 Hz).
260	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.91 (1H, s), 7.45-7.40 (1H, m), 7.24 (1H, s), 7.15-7.13 (3H, m), 6.89 (1H, s), 4.12-4.06 (1H, m), 3.79-3.77 (1H, m), 1.89 (3H, s), 1.15 (3H, t, J = 7.0 Hz).
261	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.87 (1H, s), 7.67 (1H, s), 6.82-6.79 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.20 (3H, t, J = 7.0 Hz).
262	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.87 (1H, s), 7.86 (1H, s), 6.81-6.79 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.20 (3H, t, J = 7.2 Hz).
263	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.56 (1H, s), 7.41-7.38 (1H, m), 7.23 (1H, s), 7.19-7.17 (1H, m), 7.13-7.07 (2H, m), 4.18-4.15 (1H, m), 3.78-3.75 (1H, m), 1.86 (3H, s), 1.16 (3H, t, J = 7.1 Hz).
264	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.75 (1H, s), 7.42-7.36 (1H, m), 7.23 (1H, s), 7.19-7.17 (1H, m), 7.13-7.07 (2H, m), 4.18-4.11 (1H, m), 3.79-3.75 (1H, m), 1.86 (3H, s), 1.16 (3H, t, J = 7.1 Hz).
265	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 10.40 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.372 (1H, s), 7.367 (1H, s), 6.78-6.76 (2H, m), 3.98 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.23 (3H, t, J = 7.0 Hz).
266	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.76 (1H, t, J = 1.2 Hz), 7.38 (1H, s), 7.35 (1H, s), 7.01-6.74 (3H, m), 3.92 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).
267	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.81 (1H, s), 7.69 (1H, s), 6.54-6.51 (2H, m), 3.96 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.84 (3H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz).
268	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.62-7.61 (1H, m), 7.46 (1H, d, J = 9.6 Hz), 7.32-7.24 (4H, m), 6.96 (1H, s), 6.70 (1H, d, J = 9.6 Hz), 4.32-4.29 (1H, m), 3.40-3.37 (1H, m), 1.88 (3H, s), 1.10 (3H, t, J = 7.1 Hz).
269	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.92 (1H, s), 7.63-7.61 (1H, m), 7.33-7.29 (2H, m), 7.26-7.25 (2H, m), 6.94 (1H, s), 4.36-4.33 (1H, m), 3.48-3.45 (1H, m), 1.88 (3H, s), 1.13 (3H, t, J = 7.0 Hz).
270	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.87 (1H, s, minor), 7.74 (1H, s, major), 7.22-7.15 (1H, m, mixture), 6.91-6.84 (2H, m, mixture), 4.16-4.13 (1H, br m, major), 4.10-4.03 (1H, m, minor), 3.76-3.73 (1H, m, mixture), 1.89 (3H, s, major), 1.87 (3H, s, minor), 1.16-1.15 (3H, m, mixture).

[表6-15]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
271	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.74 (1H, s), 7.58-7.57 (1H, m), 7.32-7.23 (3H, m), 7.21 (1H, s), 4.38-4.36 (1H, m), 3.51-3.47 (1H, m), 1.88 (3H, s), 1.15 (3H, t, J = 7.0 Hz).
272	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.58-7.57 (1H, m), 7.54 (1H, s), 7.34-7.23 (3H, m), 7.20 (1H, s), 4.39-4.36 (1H, m), 3.50-3.47 (1H, m), 1.88 (3H, s), 1.15 (3H, t, J = 7.1 Hz).
273	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.52 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.41-7.39 (2H, m), 7.25-7.22 (1H, m), 7.20 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.07 (1H, ddd, J = 9.5, 7.0, 1.5 Hz), 6.75 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.32-6.07 (1H, m), 4.60-4.56 (1H, m), 3.55-3.52 (1H, m).
274	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.77 (1H, s), 7.43-7.41 (2H, m), 7.25-7.22 (1H, m), 7.19 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.09-7.08 (1H, m), 6.34-6.10 (1H, m), 4.65-4.59 (1H, m), 3.61-3.58 (1H, m).
275	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.97 (1H, s), 7.42-7.41 (2H, m), 7.25-7.22 (1H, m), 7.19 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.09-7.08 (1H, m), 6.34-6.10 (1H, m), 4.66-4.57 (1H, m), 3.63-3.58 (1H, m).
276	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.52 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.49-7.46 (1H, m), 7.38 (1H, d, J = 0.5 Hz), 7.20-7.14 (4H, m), 6.74 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.19 (1H, t, dd, J = 56.8, 5.9, 3.4 Hz), 4.41-4.36 (1H, m), 3.92-3.82 (1H, m).
277	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.78 (1H, s), 7.53-7.47 (1H, m), 7.39 (1H, d, J = 0.5 Hz), 7.19-7.15 (4H, m), 6.21 (1H, tdd, J = 56.6, 5.9, 3.4 Hz), 4.50-4.38 (1H, m), 3.94-3.90 (1H, m).
278	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.97 (1H, s), 7.52-7.47 (1H, m), 7.39 (1H, d, J = 0.7 Hz), 7.21-7.13 (4H, m), 6.21 (1H, tdd, J = 56.7, 5.8, 3.3 Hz), 4.49-4.37 (1H, m), 3.94-3.91 (1H, m).
279	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.65 (1H, s), 7.49-7.46 (2H, m), 7.36-7.32 (2H, m), 7.25 (1H, br s), 4.07-4.00 (1H, m), 3.78-3.70 (1H, m), 1.17 (3H, t, J = 7.0 Hz).
280	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.85 (1H, s), 7.49-7.46 (2H, m), 7.36-7.32 (2H, m), 7.25 (1H, s), 4.07-4.00 (1H, m), 3.78-3.71 (1H, m), 1.17 (3H, t, J = 7.0 Hz).
281	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.52 (1H, s), 7.40 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.84 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.79-6.72 (2H, m), 3.91 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz).
282	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.50 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.32 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.22 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.78-6.74 (3H, m), 6.22-6.07 (1H, m), 4.14-4.12 (2H, m).
283	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.96 (1H, s), 7.34 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.22 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.77-6.75 (2H, m), 6.29-6.05 (1H, m), 4.20-4.17 (2H, m).
284	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.52 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.32 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.19-7.15 (1H, m), 7.08 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.95-6.89 (2H, m), 6.75 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.18 (1H, tdd, J = 56.8, 5.9, 3.2 Hz), 4.42-4.36 (1H, m), 3.85-3.81 (1H, m).
285	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.77 (1H, s), 7.34 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.19-7.16 (1H, m), 7.07 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.96-6.91 (2H, m), 6.21 (1H, tdd, J = 56.6, 6.0, 3.2 Hz), 4.46-4.42 (1H, m), 3.90-3.87 (1H, m).
286	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.96 (1H, s), 7.34 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.19-7.16 (1H, m), 7.07 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.96-6.91 (2H, m), 6.21 (1H, tdd, J = 56.7, 5.9, 3.3 Hz), 4.48-4.39 (1H, m), 3.91-3.88 (1H, m).
287	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.78 (1H, s), 7.42 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.18-7.17 (1H, m), 7.16 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.11 (1H, dd, J = 8.6, 2.1 Hz), 6.86 (1H, dd, J = 8.6, 2.4 Hz), 6.27-6.16 (1H, m), 4.62-4.57 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.70-3.66 (1H, m).

[表6-16]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
288	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.98 (1H, s), 7.42 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.17-7.17 (1H, m), 7.16 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.11 (1H, dd, J = 8.6, 2.1 Hz), 6.86 (1H, dd, J = 8.7, 2.6 Hz), 6.34-6.10 (1H, m), 4.62-4.54 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.71-3.67 (1H, m).
289	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.66-7.65 (1H, m), 7.55 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.39 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.35-7.34 (2H, m), 7.23-7.21 (1H, m), 7.16 (1H, d, J = 0.6 Hz), 6.75 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.32-6.08 (1H, m), 4.61-4.53 (1H, m), 3.61-3.53 (1H, m).
290	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.80 (1H, s), 7.68-7.67 (1H, m), 7.40 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.37-7.34 (2H, m), 7.23-7.20 (1H, m), 7.14 (1H, d, J = 0.6 Hz), 6.30-6.13 (1H, m), 4.63-4.60 (1H, m), 3.65-3.63 (1H, m).
291	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.00 (1H, s), 7.68-7.65 (1H, m), 7.40 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.38-7.34 (2H, m), 7.23-7.21 (1H, m), 7.15 (1H, d, J = 0.6 Hz), 6.29-6.15 (1H, m), 4.65-4.56 (1H, m), 3.67-3.62 (1H, m).
292	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.55 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.48 (1H, dd, J = 8.1, 1.2 Hz), 7.44-7.41 (1H, m), 7.38 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.29 (1H, td, J = 7.5, 1.2 Hz), 7.21-7.20 (1H, m), 7.13 (1H, d, J = 0.6 Hz), 6.75 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.32-6.07 (1H, m), 4.60-4.51 (1H, m), 3.63-3.55 (1H, m).
293	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.80 (1H, s), 7.50 (1H, dd, J = 7.8, 1.1 Hz), 7.46-7.44 (1H, m), 7.40 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.31 (1H, td, J = 7.5, 1.1 Hz), 7.21-7.20 (1H, m), 7.11 (1H, d, J = 0.6 Hz), 6.29-6.14 (1H, m), 4.63-4.57 (1H, m), 3.68-3.62 (1H, m).
294	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.99 (1H, s), 7.48-7.45 (2H, m), 7.39 (1H, s), 7.32-7.30 (1H, m), 7.21-7.19 (1H, m), 7.11 (1H, s), 6.36-6.07 (1H, m), 4.64-4.53 (1H, m), 3.69-3.63 (1H, m).
295	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.28-7.25 (1H, m), 6.85-6.80 (3H, m), 6.48 (1H, d, J = 5.6 Hz), 3.43 (2H, q, J = 7.1 Hz), 2.76-2.67 (4H, m), 0.97 (3H, t, J = 5.6 Hz).
296	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.39-7.32 (1H, m), 7.36 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.90 (2H, dd, J = 8.4, 7.2 Hz), 6.85 (1H, d, J = 5.6 Hz), 6.73 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.53 (1H, d, J = 5.6 Hz), 3.91 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.15 (3H, t, J = 7.1 Hz).
297	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.55 (1H, s), 7.43 (1H, tt, J = 8.6, 6.4 Hz), 6.98-6.96 (2H, m), 6.41 (1H, s), 3.95 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
298	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.60 (1H, s), 7.38 (1H, tt, J = 8.4, 6.4 Hz), 6.92-6.90 (2H, m), 6.87 (1H, d, J = 5.8 Hz), 6.54 (1H, d, J = 5.8 Hz), 3.96 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.17 (3H, t, J = 7.0 Hz).
299	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.80 (1H, s), 7.37 (1H, tt, J = 8.4, 6.4 Hz), 6.92-6.90 (2H, m), 6.87 (1H, d, J = 5.8 Hz), 6.54 (1H, d, J = 5.8 Hz), 3.96 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
300	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.43 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.32 (1H, dd, J = 3.9, 0.7 Hz), 7.06-7.01 (2H, m), 6.69-6.67 (3H, m), 4.04-4.01 (1H, m), 3.83 (3H, s), 3.37-3.71 (1H, m), 1.13 (3H, t, J = 7.0 Hz).
301	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.70 (1H, s), 7.33 (1H, dd, J = 4.0, 0.6 Hz), 7.06-7.01 (2H, m), 6.70-6.67 (2H, m), 4.12-4.01 (1H, m), 3.82-3.77 (4H, m), 1.15 (3H, t, J = 7.1 Hz).
302	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.89 (1H, s), 7.34-7.33 (1H, m), 7.05-7.02 (2H, m), 6.69-6.67 (2H, m), 4.09-4.06 (1H, m), 3.81-3.79 (4H, m), 1.15 (3H, t, J = 7.0 Hz).
303	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.64 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.34-7.33 (1H, m), 7.26-7.18 (4H, m), 6.71-6.69 (1H, m), 6.67-6.66 (1H, m), 6.25 (1H, tdd, J = 57.1, 5.7, 3.6 Hz), 4.35-4.26 (1H, m), 3.85-3.82 (1H, m), 2.05 (3H, s), 1.86 (3H, s).

[表6-17]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
304	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.10 (1H, s), 7.37-7.35 (1H, m), 7.27-7.26 (2H, m), 7.23-7.22 (1H, m), 7.19-7.18 (1H, m), 6.64 (1H, s), 6.28 (1H, tdd, J = 57.0, 5.6, 3.6 Hz), 4.37-4.32 (1H, m), 3.91-3.88 (1H, m), 2.04 (3H, s), 1.86 (3H, s).
305	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.55 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.45-7.43 (1H, m), 7.25 (1H, s), 7.15-7.13 (3H, m), 6.87 (1H, s), 6.73 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.19 (1H, tdd, J = 56.7, 5.8, 3.3 Hz), 4.45-4.35 (1H, m), 3.90-3.83 (1H, m), 1.89 (3H, s).
306	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.60 (1H, s), 7.31-7.28 (1H, m), 7.21-7.15 (4H, m), 6.31-6.20 (1H, m), 4.42-4.39 (1H, br m), 3.83-3.75 (1H, m), 2.18 (3H, s), 1.86 (3H, s).
307	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.80 (1H, s), 7.31-7.26 (1H, m), 7.20-7.14 (4H, m), 6.33-6.19 (1H, m), 4.44-4.39 (1H, m), 3.84-3.74 (1H, m), 2.18 (3H, s), 1.86 (3H, s).
308	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.43 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.33 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.17 (1H, d, J = 4.2 Hz), 6.72 (2H, d, J = 9.5 Hz), 6.50-6.47 (2H, m), 3.89 (2H, q, J = 7.2 Hz), 3.82 (3H, s), 1.16 (3H, t, J = 7.2 Hz).
309	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.00 (1H, s), 7.47-7.45 (1H, m), 7.26 (1H, s), 7.16-7.13 (3H, m), 6.86 (1H, s), 6.21 (1H, tdd, J = 56.6, 6.0, 3.2 Hz), 4.49-4.40 (1H, m), 3.93-3.90 (1H, m), 1.89 (3H, s).
310	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.63 (1H, s), 7.44-7.41 (1H, m), 7.26 (1H, s), 7.18-7.16 (1H, m), 7.12-7.10 (2H, m), 6.35-6.04 (1H, m), 4.59-4.54 (1H, m), 3.91-3.86 (1H, m), 1.86 (3H, s).
311	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.43 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.33 (1H, d, J = 4.6 Hz), 7.17 (1H, d, J = 4.6 Hz), 6.71 (2H, d, J = 9.8 Hz), 6.48-6.45 (2H, m), 4.01 (2H, q, J = 7.0 Hz), 3.89 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.43 (3H, t, J = 7.0 Hz), 1.16 (3H, t, J = 7.0 Hz).
312	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.83 (1H, s), 7.45-7.39 (1H, m), 7.26 (1H, s), 7.18-7.17 (1H, m), 7.13-7.09 (2H, m), 6.35-6.04 (1H, m), 4.61-4.51 (1H, m), 3.91-3.88 (1H, m), 1.86 (3H, s).
313	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.92 (1H, s), 7.49-7.47 (1H, m), 7.42-7.41 (1H, m), 7.31-7.28 (2H, m), 7.23-7.22 (1H, m), 7.08-7.07 (1H, m), 4.30-4.25 (1H, m), 3.54-3.49 (1H, m), 1.13 (3H, t, J = 7.0 Hz).
314	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.69 (1H, s), 7.34 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.17 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.51-6.48 (2H, m), 3.95 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.83 (3H, s), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
315	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.89 (1H, s), 7.34 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.17 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.51-6.49 (2H, m), 3.95 (2H, q, J = 7.0 Hz), 3.83 (3H, s), 1.18 (3H, t, J = 7.0 Hz).
316	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.69 (1H, s), 7.34 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.16 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.49-6.46 (2H, m), 4.02 (2H, q, J = 7.0 Hz), 3.95 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.44 (3H, t, J = 7.0 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.2 Hz).
317	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.89 (1H, s), 7.34 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.16 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.48-6.46 (2H, m), 4.02 (2H, q, J = 7.0 Hz), 3.95 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.44 (3H, t, J = 7.0 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.2 Hz).
318	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.45-7.43 (2H, m), 7.29 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.18 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.97-6.96 (2H, m), 6.73 (1H, d, J = 9.8 Hz), 3.88 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.16 (3H, t, J = 7.0 Hz).
319	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.70 (1H, s), 7.47-7.45 (1H, m), 7.30 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.18 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.00-6.96 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.2 Hz).
320	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.90 (1H, s), 7.46-7.44 (1H, m), 7.30 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.18 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.00-6.95 (2H, m), 3.94 (2H, q, J = 7.2 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.2 Hz).

[表6-18]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
321	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.00 (1H, s), 7.42-7.38 (1H, m), 7.30-7.20 (4H, m), 6.66 (1H, s), 4.22-4.15 (1H, m), 3.54-3.49 (1H, m), 2.38-2.34 (2H, m), 1.86 (3H, s), 1.14 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.07 (3H, t, J = 7.6 Hz).
322	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.71 (1H, s), 7.36-7.32 (1H, m), 7.25 (1H, s), 7.19-7.14 (3H, m), 4.28-4.23 (1H, m), 3.47-3.38 (1H, m), 2.59-2.57 (1H, m), 2.44-2.40 (1H, m), 1.86 (3H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.6 Hz), 1.14 (3H, t, J = 7.1 Hz).
323	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.43 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.39-7.37 (1H, m), 7.02 (1H, d, J = 5.8 Hz), 6.91-6.90 (2H, m), 6.76 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.55 (1H, d, J = 5.8 Hz), 6.16 (1H, tt, J = 56.7, 4.5 Hz), 4.17 (2H, td, J = 13.0, 4.5 Hz).
324	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.44 (1H, tt, J = 8.4, 3.5 Hz), 7.38 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.96-6.94 (2H, m), 6.75 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.55 (1H, s), 6.15 (1H, tt, J = 56.6, 4.5 Hz), 4.16 (2H, td, J = 12.9, 4.5 Hz).
325	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.81 (1H, s), 7.47-7.43 (1H, m), 6.97-6.95 (2H, m), 6.56 (1H, s), 6.17 (1H, tt, J = 56.4, 4.4 Hz), 4.21 (2H, td, J = 12.7, 4.4 Hz).
326	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.43 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.39 (1H, dd, J = 7.8, 2.4 Hz), 7.30 (1H, dd, J = 3.9, 0.7 Hz), 7.26 (1H, dd, J = 8.2, 6.0 Hz), 7.15 (1H, dd, J = 4.9, 0.7 Hz), 7.07-7.05 (1H, m), 6.71 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.31-4.27 (1H, m), 3.39-3.34 (1H, m), 1.11 (3H, t, J = 7.1 Hz).
327	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.44 (1H, d, J = 9.6 Hz), 7.30 (1H, dd, J = 3.9, 0.7 Hz), 7.25-7.20 (2H, m), 7.11 (1H, dd, J = 4.9, 0.7 Hz), 7.04-6.98 (1H, m), 6.71 (1H, d, J = 9.6 Hz), 4.28-4.19 (1H, m), 3.46-3.36 (1H, m), 1.11 (3H, t, J = 7.1 Hz).
328	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.67 (1H, s), 7.30-7.29 (1H, m), 7.23-7.20 (2H, m), 7.09-7.07 (1H, m), 7.00 (1H, td, J = 8.3, 2.5 Hz), 4.30-4.22 (1H, m), 3.50-3.42 (1H, m), 1.12 (3H, t, J = 7.0 Hz).
329	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.87 (1H, s), 7.30-7.28 (1H, m), 7.23-7.20 (2H, m), 7.09-7.07 (1H, m), 7.02-6.98 (1H, m), 4.30-4.21 (1H, m), 3.51-3.42 (1H, m), 1.11 (3H, t, J = 7.0 Hz).
330	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.43 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.37-7.35 (1H, m), 7.28-7.26 (1H, m), 7.24 (1H, s), 7.04-7.02 (1H, m), 6.98 (1H, s), 6.70 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.32-4.29 (1H, m), 3.37-3.35 (1H, m), 1.92 (3H, s), 1.11 (3H, t, J = 7.0 Hz).
331	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.53 (1H, s), 7.35-7.32 (2H, m), 7.23 (1H, s), 7.03-7.01 (1H, m), 4.39-4.36 (1H, m), 3.48-3.45 (1H, m), 1.91 (3H, s), 1.15 (3H, t, J = 7.0 Hz).
332	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.89 (1H, s), 7.38-7.36 (1H, m), 7.28-7.25 (2H, m), 7.05-7.03 (1H, m), 6.97 (1H, s), 4.36-4.31 (1H, m), 3.46-3.42 (1H, m), 1.92 (3H, s), 1.13 (3H, t, J = 7.1 Hz).
333	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.73 (1H, s), 7.34-7.32 (2H, m), 7.23 (1H, s), 7.03-7.01 (1H, m), 4.39-4.34 (1H, m), 3.49-3.45 (1H, m), 1.90 (3H, s), 1.15 (3H, t, J = 7.1 Hz).
334	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.43 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.25-7.23 (2H, m), 7.20-7.18 (1H, m), 6.98-6.97 (1H, m), 6.95 (1H, s), 6.70 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.28-4.23 (1H, m), 3.42-3.39 (1H, m), 1.92 (3H, s), 1.11 (3H, t, J = 7.2 Hz).
335	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.89 (1H, s), 7.25-7.20 (3H, m), 7.01-6.96 (1H, m), 6.93 (1H, s), 4.32-4.27 (1H, m), 3.50-3.46 (1H, m), 1.92 (3H, s), 1.13 (3H, t, J = 7.0 Hz).
336	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.54 (1H, s), 7.31-7.30 (1H, br m), 7.23 (1H, s), 7.16-7.15 (1H, m), 6.98-6.96 (1H, m), 4.35-4.33 (1H, m), 3.51-3.49 (1H, m), 1.90 (3H, s), 1.15 (3H, t, J = 7.0 Hz).

[表6-19]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
337	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.74 (1H, s), 7.31-7.29 (1H, br m), 7.23 (1H, s), 7.16-7.15 (1H, m), 6.99-6.95 (1H, m), 4.35-4.32 (1H, m), 3.53-3.49 (1H, m), 1.90 (3H, s), 1.15 (3H, t, J = 7.2 Hz).
338	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.54 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.38 (1H, dd, J = 8.0, 2.4 Hz), 7.25-7.23 (2H, m), 7.04-7.03 (1H, m), 6.93 (1H, s), 6.73 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.32-6.07 (1H, m), 4.63-4.54 (1H, m), 3.55-3.53 (1H, m), 1.92 (3H, s).
339	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.99 (1H, s), 7.39 (1H, dd, J = 7.8, 2.4 Hz), 7.27-7.22 (2H, m), 7.06-7.04 (1H, m), 6.91 (1H, s), 6.37-6.06 (1H, m), 4.67-4.56 (1H, m), 3.66-3.56 (1H, m), 1.92 (3H, s).
340	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.61 (1H, s), 7.35-7.33 (1H, m), 7.32-7.29 (1H, br m), 7.24 (1H, s), 7.03-7.01 (1H, m), 6.29-6.14 (1H, m), 4.69-4.65 (1H, m), 3.66-3.61 (1H, m), 1.91 (3H, s).
341	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.81 (1H, s), 7.35-7.31 (2H, m), 7.24 (1H, s), 7.04-7.00 (1H, m), 6.34-6.09 (1H, m), 4.71-4.62 (1H, m), 3.67-3.63 (1H, m), 1.91 (3H, s).
342	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.54 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.26 (1H, s), 7.23-7.20 (2H, m), 7.00-6.97 (1H, m), 6.90 (1H, s), 6.73 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.34-6.04 (1H, m), 4.63-4.51 (1H, m), 3.58-3.53 (1H, m), 1.92 (3H, s).
343	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.61 (1H, s), 7.26-7.24 (2H, m), 7.18-7.16 (1H, m), 7.00-6.95 (1H, m), 6.35-6.06 (1H, m), 4.72-4.61 (1H, m), 3.67-3.62 (1H, m), 1.90 (3H, s).
344	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.99 (1H, s), 7.27 (1H, s), 7.23-7.21 (2H, m), 7.01-6.99 (1H, m), 6.88 (1H, s), 6.33-6.09 (1H, m), 4.64-4.55 (1H, m), 3.63-3.60 (1H, m), 1.92 (3H, s).
345	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.81 (1H, s), 7.30-7.26 (2H, m), 7.18-7.16 (1H, m), 6.98-6.96 (1H, m), 6.36-6.05 (1H, m), 4.71-4.59 (1H, m), 3.70-3.61 (1H, m), 1.90 (3H, s).
346	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.86 (1H, s), 7.42-7.37 (1H, m), 7.04 (1H, d, J = 5.8 Hz), 6.93-6.89 (2H, m), 6.56 (1H, d, J = 5.8 Hz), 6.18 (1H, tt, J = 56.4, 4.6 Hz), 4.22 (2H, td, J = 12.7, 4.6 Hz).
347	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.66 (1H, s), 7.44-7.36 (1H, m), 7.04 (1H, d, J = 5.9 Hz), 6.95-6.88 (2H, m), 6.56 (1H, d, J = 5.9 Hz), 6.18 (1H, tt, J = 56.5, 4.5 Hz), 4.22 (2H, td, J = 12.8, 4.5 Hz).
348	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.48-7.39 (1H, m), 7.38 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.99-6.93 (2H, m), 6.75 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.42 (1H, s), 6.15 (1H, tt, J = 56.6, 4.4 Hz), 4.16 (2H, td, J = 12.9, 4.4 Hz).
349	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.61 (1H, s), 7.50-7.42 (1H, m), 7.00-6.94 (2H, m), 6.43 (1H, s), 6.17 (1H, tt, J = 56.4, 4.5 Hz), 4.21 (2H, td, J = 12.8, 4.5 Hz).
350	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.47-7.45 (2H, m), 7.40 (1H, td, J = 7.8, 1.8 Hz), 7.30-7.28 (2H, m), 7.23 (1H, dd, J = 7.6, 1.8 Hz), 7.09 (1H, dd, J = 4.7, 0.8 Hz), 6.70 (1H, d, J = 9.5 Hz), 4.25-4.23 (1H, m), 3.47-3.42 (1H, m), 1.11 (3H, t, J = 7.0 Hz).
351	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.72 (1H, s), 7.48 (1H, dd, J = 8.1, 1.0 Hz), 7.43-7.40 (1H, m), 7.31 (1H, dd, J = 3.9, 0.7 Hz), 7.29 (1H, dd, J = 7.4, 1.3 Hz), 7.22 (1H, dd, J = 7.9, 1.6 Hz), 7.08 (1H, dd, J = 4.9, 0.7 Hz), 4.33-4.24 (1H, m), 3.55-3.46 (1H, m), 1.14 (3H, t, J = 7.1 Hz).
352	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.69 (1H, s), 7.40 (1H, dd, J = 7.8, 2.4 Hz), 7.32 (1H, dd, J = 4.2, 0.7 Hz), 7.26 (1H, dd, J = 8.5, 5.6 Hz), 7.14 (1H, dd, J = 4.9, 0.7 Hz), 7.10-7.05 (1H, m), 4.38-4.29 (1H, m), 3.48-3.40 (1H, m), 1.14 (3H, t, J = 7.1 Hz).

[表6-20]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
353	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.90 (1H, s), 7.40 (1H, dd, J = 7.8, 2.6 Hz), 7.32 (1H, dd, J = 4.0, 0.6 Hz), 7.27 (1H, dd, J = 8.4, 5.4 Hz), 7.15 (1H, dd, J = 4.9, 0.6 Hz), 7.10-7.05 (1H, m), 4.36-4.29 (1H, m), 3.48-3.42 (1H, m), 1.14 (3H, t, J = 7.0 Hz).
354	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.45 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.32 (1H, dd, J = 4.2, 0.7 Hz), 7.17-7.11 (3H, m), 6.83 (1H, dd, J = 8.7, 2.6 Hz), 6.69 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.33-4.23 (1H, m), 3.83 (3H, s), 3.46-3.37 (1H, m), 1.11 (3H, t, J = 7.0 Hz).
355	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.72 (1H, s), 7.33 (1H, dd, J = 4.2, 0.7 Hz), 7.16 (1H, d, J = 2.7 Hz), 7.14-7.11 (2H, m), 6.85 (1H, dd, J = 8.5, 2.4 Hz), 4.37-4.28 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.54-3.44 (1H, m), 1.13 (3H, t, J = 7.1 Hz).
356	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.65-7.63 (1H, m), 7.46 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.35-7.29 (3H, m), 7.26-7.24 (1H, m), 7.13 (1H, dd, J = 4.9, 0.9 Hz), 6.71 (1H, d, J = 9.5 Hz), 4.29 (1H, td, J = 13.6, 7.0 Hz), 3.39 (1H, td, J = 13.6, 7.0 Hz), 1.11 (3H, t, J = 7.0 Hz).
357	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.72 (1H, s), 7.66-7.64 (1H, m), 7.35-7.31 (3H, m), 7.25-7.23 (1H, m), 7.11 (1H, dd, J = 4.9, 0.7 Hz), 4.34 (1H, dt, J = 20.3, 7.1 Hz), 3.46 (1H, dt, J = 20.3, 7.1 Hz), 1.14 (3H, t, J = 7.1 Hz).
358	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.92 (1H, s), 7.66-7.64 (1H, m), 7.35-7.30 (3H, m), 7.25-7.23 (1H, m), 7.12 (1H, dd, J = 4.9, 0.7 Hz), 4.33 (1H, dt, J = 20.3, 7.1 Hz), 3.47 (1H, dt, J = 20.3, 7.1 Hz), 1.13 (3H, t, J = 7.1 Hz).
359	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.36-7.31 (1H, m), 7.34 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.00 (1H, d, J = 5.1 Hz), 6.88 (2H, dd, J = 8.3, 7.3 Hz), 6.70 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.69 (1H, d, J = 5.1 Hz), 3.90 (2H, q, J = 7.1 Hz), 2.04 (3H, s), 1.15 (3H, t, J = 7.1 Hz).
360	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.46 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.44-7.42 (1H, m), 7.33 (1H, td, J = 8.3, 5.8 Hz), 7.30 (1H, dd, J = 4.0, 0.6 Hz), 7.21 (1H, dd, J = 4.9, 0.6 Hz), 7.14 (1H, td, J = 8.3, 1.0 Hz), 6.75 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.17-4.10 (1H, m), 3.58-3.51 (1H, m), 1.17 (3H, t, J = 7.2 Hz).
361	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.71 (1H, s), 7.33 (1H, dd, J = 4.0, 0.6 Hz), 7.11 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.07 (1H, dd, J = 4.6, 0.6 Hz), 6.99 (1H, d, J = 2.4 Hz), 6.80 (1H, dd, J = 8.6, 2.4 Hz), 4.31-4.25 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.56-3.49 (1H, m), 1.13 (3H, t, J = 7.0 Hz).
362	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.45 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.31 (1H, dd, J = 3.9, 0.7 Hz), 7.12 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.09 (1H, dd, J = 4.6, 0.7 Hz), 6.98 (1H, d, J = 2.4 Hz), 6.79 (1H, dd, J = 8.7, 2.4 Hz), 6.69 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.28-4.18 (1H, m), 3.83 (3H, s), 3.49-3.43 (1H, m), 1.10 (3H, t, J = 7.0 Hz).
363	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.91 (1H, s), 7.33 (1H, dd, J = 3.9, 0.7 Hz), 7.11 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.08 (1H, dd, J = 4.9, 0.7 Hz), 6.99 (1H, d, J = 2.4 Hz), 6.80 (1H, dd, J = 8.5, 2.4 Hz), 4.32-4.23 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.58-3.48 (1H, m), 1.13 (3H, t, J = 7.1 Hz).
364	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.42-7.34 (2H, m), 7.10 (1H, d, J = 5.3 Hz), 6.94-6.90 (2H, m), 6.85 (1H, d, J = 5.3 Hz), 6.73 (1H, d, J = 9.5 Hz), 3.91 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.16 (3H, t, J = 7.0 Hz).
365	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.64 (1H, s), 7.42-7.36 (1H, m), 7.12 (1H, d, J = 5.5 Hz), 6.95-6.90 (2H, m), 6.86 (1H, d, J = 5.5 Hz), 3.96 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.0 Hz).
366	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.44 (1H, d, J = 9.3 Hz), 7.39 (1H, tt, J = 8.4, 6.4 Hz), 6.93-6.87 (3H, m), 6.76 (1H, d, J = 9.3 Hz), 6.55 (1H, d, J = 5.9 Hz), 6.15 (1H, tt, J = 56.6, 4.4 Hz), 4.18 (2H, td, J = 12.9, 4.4 Hz).
367	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.48 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.24 (1H, s), 7.18-7.16 (1H, m), 6.92-6.90 (2H, m), 6.74 (1H, s), 6.67 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.20-4.12 (1H, m), 3.46-3.43 (1H, m), 2.12 (3H, s), 1.90 (3H, s), 1.10 (3H, t, J = 6.9 Hz).

[表6-21]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
368	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.71 (1H, s), 7.29 (1H, s), 6.89-6.87 (1H, m), 6.26-6.22 (2H, m), 4.22-4.20 (1H, br m), 4.06 (1H, br s), 3.83-3.80 (1H, br m), 2.82 (3H, d, J = 5.1 Hz), 1.89 (3H, s), 1.15 (3H, t, J = 7.1 Hz).
369	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.52 (1H, s), 7.21-7.18 (2H, m), 6.88-6.85 (2H, m), 4.29-4.27 (1H, br m), 3.45-3.42 (1H, m), 2.21 (3H, s), 1.88 (3H, s), 1.13 (3H, t, J = 7.1 Hz).
370	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.94 (1H, s), 7.24 (1H, s), 7.18-7.14 (1H, m), 6.94-6.91 (2H, m), 6.73 (1H, s), 4.23-4.20 (1H, m), 3.54-3.49 (1H, m), 2.12 (3H, s), 1.90 (3H, s), 1.12 (3H, t, J = 7.1 Hz).
371	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.72 (1H, s), 7.21-7.18 (2H, m), 6.88-6.85 (2H, m), 4.27-4.25 (1H, br m), 3.45-3.42 (1H, m), 2.21 (3H, s), 1.88 (3H, s), 1.13 (3H, t, J = 7.0 Hz).
372	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.70-7.69 (1H, m), 7.58-7.55 (2H, m), 7.48-7.47 (1H, m), 7.40 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.18 (1H, s), 6.89 (1H, s), 6.68 (1H, d, J = 9.5 Hz), 4.29-4.25 (1H, m), 3.24-3.20 (1H, m), 1.88 (3H, s), 1.11 (3H, t, J = 7.0 Hz).
373	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.73 (1H, s), 7.27 (1H, s), 7.07-7.05 (1H, m), 6.92-6.90 (2H, m), 4.17-4.15 (1H, br m), 3.78-3.76 (1H, m), 2.48 (3H, s), 1.89 (3H, s), 1.16 (3H, t, J = 7.0 Hz).
374	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.86 (1H, s), 7.71-7.70 (1H, m), 7.60-7.57 (2H, m), 7.47-7.46 (1H, m), 7.18 (1H, s), 6.88 (1H, s), 4.32-4.30 (1H, m), 3.31-3.28 (1H, m), 1.88 (3H, s), 1.13 (3H, t, J = 7.0 Hz).
375	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.67-7.65 (1H, m), 7.58-7.56 (2H, m), 7.53 (1H, s), 7.47-7.45 (1H, m), 7.15 (1H, s), 4.31-4.28 (1H, m), 3.38-3.35 (1H, m), 1.87 (3H, s), 1.15 (3H, t, J = 7.0 Hz).
376	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.83 (1H, s), 7.36 (1H, s), 7.04-7.02 (1H, m), 6.91-6.88 (1H, m), 5.23 (2H, s), 1.90 (3H, s).
377	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.36-7.26 (2H, m), 6.87 (2H, dd, J = 8.3, 7.3 Hz), 6.80 (1H, d, J = 5.2 Hz), 6.71 (1H, d, J = 9.3 Hz), 6.54 (1H, d, J = 5.2 Hz), 3.90 (2H, q, J = 7.1 Hz), 2.25 (3H, s), 1.15 (3H, t, J = 7.1 Hz).
378	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.45 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.40 (1H, td, J = 8.3, 5.9 Hz), 7.30 (1H, dd, J = 4.0, 0.6 Hz), 7.27-7.25 (1H, m), 7.19 (1H, dd, J = 4.9, 0.6 Hz), 7.09 (1H, td, J = 8.3, 0.9 Hz), 6.74 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.13-4.04 (1H, m), 3.64-3.55 (1H, m), 1.16 (3H, t, J = 7.2 Hz).
379	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.71 (1H, s), 7.42 (1H, td, J = 8.4, 5.9 Hz), 7.31 (1H, dd, J = 4.0, 0.9 Hz), 7.29-7.26 (1H, m), 7.18 (1H, dd, J = 4.9, 0.9 Hz), 7.10 (1H, td, J = 8.4, 0.9 Hz), 4.18-4.10 (1H, m), 3.70-3.63 (1H, m), 1.19 (3H, t, J = 7.0 Hz).
380	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.91 (1H, s), 7.42 (1H, td, J = 8.4, 6.1 Hz), 7.31 (1H, dd, J = 3.9, 0.6 Hz), 7.29-7.26 (1H, m), 7.18 (1H, dd, J = 4.9, 0.6 Hz), 7.10 (1H, td, J = 8.4, 0.9 Hz), 4.18-4.11 (1H, m), 3.71-3.62 (1H, m), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz).
381	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.57 (1H, s), 7.38-7.32 (1H, m), 7.02 (1H, d, J = 5.0 Hz), 6.89 (2H, dd, J = 8.6, 7.0 Hz), 6.69 (1H, d, J = 5.0 Hz), 3.95 (2H, q, J = 7.1 Hz), 2.05 (3H, s), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
382	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.47-7.41 (1H, m), 7.45 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.29 (1H, dd, J = 4.0, 0.9 Hz), 7.18-7.13 (3H, m), 7.06 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.70 (1H, d, J = 9.5 Hz), 4.02 (1H, dt, J = 20.3, 7.1 Hz), 3.72 (1H, td, J = 13.7, 6.9 Hz), 1.13 (3H, t, J = 7.0 Hz).
383	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.71 (1H, s), 7.49-7.44 (1H, m), 7.31 (1H, dd, J = 4.2, 0.7 Hz), 7.19-7.15 (3H, m), 7.05 (1H, d, J = 4.9 Hz), 4.07 (1H, td, J = 13.7, 7.1 Hz), 3.79 (1H, td, J = 13.7, 7.1 Hz), 1.16 (3H, t, J = 7.1 Hz).

[表6-22]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
384	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.90 (1H, s), 7.49-7.44 (1H, m), 7.30 (1H, dd, J = 3.9, 0.7 Hz), 7.19-7.13 (3H, m), 7.05 (1H, d, J = 4.6 Hz), 4.07 (1H, td, J = 13.6, 7.1 Hz), 3.83-3.75 (1H, m), 1.16 (3H, t, J = 7.1 Hz).
385	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.42 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.40-7.34 (1H, m), 7.03 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.91-6.88 (2H, m), 6.73 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.70 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.17 (1H, tt, J = 56.7, 4.5 Hz), 4.17 (2H, td, J = 12.8, 4.5 Hz), 2.04 (3H, s).
386	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.43-7.35 (1H, m), 7.29 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.93 (2H, dd, J = 8.4, 7.2 Hz), 6.69 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.66 (1H, s), 3.88 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.98 (3H, s), 1.14 (3H, t, J = 7.1 Hz).
387	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.53 (1H, s), 7.45-7.37 (1H, m), 6.94 (2H, dd, J = 8.4, 7.2 Hz), 6.66 (1H, s), 3.93 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.99 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
388	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.74 (1H, s), 7.44-7.37 (1H, m), 6.94 (2H, dd, J = 8.5, 7.3 Hz), 6.66 (1H, s), 3.93 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.99 (3H, s), 1.16 (3H, t, J = 7.1 Hz).
389	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.78 (1H, s), 7.39-7.31 (1H, m), 7.02 (1H, d, J = 5.1 Hz), 6.89 (2H, dd, J = 8.5, 7.1 Hz), 6.69 (1H, d, J = 5.1 Hz), 3.95 (2H, q, J = 7.1 Hz), 2.05 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
390	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.52 (1H, s), 7.36-7.30 (1H, m), 6.89-6.86 (2H, m), 6.81 (1H, d, J = 5.2 Hz), 6.54 (1H, d, J = 5.2 Hz), 3.95 (2H, q, J = 7.0 Hz), 2.26 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.0 Hz).
391	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.72 (1H, s), 7.44 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.35 (1H, td, J = 8.3, 5.8 Hz), 7.32-7.31 (1H, m), 7.20 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.16-7.13 (1H, m), 4.22-4.15 (1H, m), 3.65-3.58 (1H, m), 1.20 (3H, t, J = 7.0 Hz).
392	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.92 (1H, s), 7.44 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.35 (1H, td, J = 8.0, 5.8 Hz), 7.32 (1H, d, J = 4.0 Hz), 7.20 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.16-7.13 (1H, m), 4.22-4.15 (1H, m), 3.65-3.58 (1H, m), 1.20 (3H, t, J = 7.2 Hz).
393	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.41-7.34 (1H, m), 7.41 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.09 (1H, d, J = 5.6 Hz), 6.95-6.89 (2H, m), 6.79 (1H, d, J = 5.6 Hz), 6.73 (1H, d, J = 9.5 Hz), 3.91 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.15 (3H, t, J = 7.1 Hz).
394	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.49 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.45-7.37 (1H, m), 7.13 (1H, d, J = 5.4 Hz), 6.95-6.90 (2H, m), 6.80 (1H, d, J = 5.4 Hz), 6.76 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.15 (1H, tt, J = 56.6, 4.4 Hz), 4.18 (2H, td, J = 12.9, 4.4 Hz).
395	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.65 (1H, s), 7.42-7.36 (1H, m), 7.12 (1H, d, J = 5.5 Hz), 6.95-6.91 (2H, m), 6.79 (1H, d, J = 5.5 Hz), 3.96 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.1 Hz).
396	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.60 (1H, s), 7.49-7.41 (1H, m), 7.00-6.95 (2H, m), 6.66 (1H, s), 3.95 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
397	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.85 (1H, s), 7.43-7.36 (1H, m), 7.12 (1H, d, J = 5.4 Hz), 6.95-6.90 (2H, m), 6.79 (1H, d, J = 5.4 Hz), 3.96 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
398	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.80 (1H, s), 7.49-7.41 (1H, m), 7.00-6.94 (2H, m), 6.78 (1H, s), 3.95 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
399	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.85 (1H, s), 7.37 (1H, tt, J = 8.4, 6.4 Hz), 6.93 (1H, d, J = 5.8 Hz), 6.90-6.88 (2H, m), 6.57 (1H, d, J = 5.8 Hz), 5.18 (2H, s).
400	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.81 (1H, s), 7.52-7.42 (1H, m), 7.00-6.95 (2H, m), 6.57 (1H, s), 6.16 (1H, tt, J = 56.5, 4.5 Hz), 4.22 (2H, td, J = 12.7, 4.5 Hz).
401	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.44 (1H, tt, J = 8.5, 6.4 Hz), 7.38 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.97-6.95 (2H, m), 6.75 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.55 (1H, s), 6.14 (1H, tt, J = 56.6, 4.5 Hz), 4.19-4.13 (2H, m).

[表6-23]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
402	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.86 (1H, s), 7.43-7.37 (1H, m), 6.93-6.90 (3H, m), 6.56 (1H, d, J = 5.9 Hz), 6.18 (1H, tt, J = 55.4, 4.3 Hz), 4.22 (2H, td, J = 12.8, 4.3 Hz).
403	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.61 (1H, s), 7.49-7.43 (1H, m), 6.98-6.96 (2H, m), 6.57 (1H, s), 6.16 (1H, tt, J = 56.6, 4.6 Hz), 4.22 (2H, td, J = 12.7, 4.6 Hz).
404	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.66 (1H, s), 7.41 (1H, tt, J = 8.4, 6.4 Hz), 6.92-6.91 (3H, m), 6.56 (1H, d, J = 5.9 Hz), 6.18 (1H, tt, J = 56.5, 4.5 Hz), 4.22 (2H, td, J = 12.8, 4.5 Hz).
405	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.64-7.63 (1H, m), 7.57 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.31-7.29 (2H, m), 7.27 (1H, s), 7.23-7.22 (1H, m), 6.89 (1H, s), 6.73 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.35-6.05 (1H, m), 4.64-4.52 (1H, m), 3.63-3.53 (1H, m), 1.88 (3H, s).
406	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.46 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.27 (1H, s), 7.10-7.08 (1H, m), 6.91-6.85 (3H, m), 6.71 (1H, d, J = 9.8 Hz), 3.34 (3H, s), 1.93 (3H, s).
407	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.61 (1H, s), 7.60-7.58 (1H, m), 7.28-7.27 (3H, m), 7.22 (1H, s), 6.34-6.10 (1H, m), 4.72-4.62 (1H, m), 3.68-3.66 (1H, m), 1.88 (3H, s).
408	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.02 (1H, s), 7.66-7.63 (1H, m), 7.34-7.29 (2H, m), 7.27 (1H, s), 7.24-7.21 (1H, m), 6.87 (1H, s), 6.35-6.10 (1H, m), 4.66-4.56 (1H, m), 3.67-3.63 (1H, m), 1.88 (3H, s).
409	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.81 (1H, s), 7.60-7.57 (1H, m), 7.29-7.26 (3H, m), 7.22 (1H, s), 6.37-6.07 (1H, m), 4.72-4.60 (1H, m), 3.69-3.67 (1H, m), 1.88 (3H, s).
410	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.58 (1H, s), 7.30 (1H, s), 7.11-7.10 (1H, m), 6.91-6.89 (1H, m), 6.83-6.81 (1H, m), 3.45 (3H, s), 1.89 (3H, s).
411	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.91 (1H, s), 7.28 (1H, s), 7.10-7.08 (1H, m), 6.93-6.91 (1H, m), 6.87-6.85 (2H, m), 3.41 (3H, s), 1.93 (3H, s).
412	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.78 (1H, s), 7.30 (1H, s), 7.12-7.09 (1H, m), 6.91-6.88 (1H, m), 6.83-6.81 (1H, m), 3.45 (3H, s), 1.89 (3H, s).
413	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.46-7.43 (2H, m), 7.31 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.17 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.00-6.96 (2H, m), 6.76 (1H, d, J = 9.5 Hz), 3.38 (3H, s).
414	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.80 (1H, s), 7.34 (1H, s), 7.12-7.08 (1H, m), 6.85-6.83 (1H, m), 6.78-6.76 (1H, m), 5.97 (1H, q, J = 5.9 Hz), 2.46 (3H, d, J = 5.9 Hz), 1.89 (3H, s).
415	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.79 (1H, s), 7.47-7.42 (1H, m), 6.99-6.95 (2H, m), 6.83 (1H, s), 3.94 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.17 (3H, t, J = 7.0 Hz).
416	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.84 (1H, s), 7.42-7.36 (1H, m), 7.12 (1H, d, J = 5.4 Hz), 6.95-6.90 (2H, m), 6.85 (1H, d, J = 5.4 Hz), 3.96 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.18 (3H, t, J = 7.0 Hz).
417	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.46-7.39 (1H, m), 7.35 (1H, d, J = 9.3 Hz), 7.00-6.94 (2H, m), 6.83 (1H, s), 6.72 (1H, d, J = 9.3 Hz), 3.89 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.15 (3H, t, J = 7.0 Hz).
418	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.48 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.43-7.37 (1H, m), 7.13 (1H, d, J = 5.2 Hz), 6.95-6.90 (2H, m), 6.86 (1H, d, J = 5.2 Hz), 6.76 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.16 (1H, tt, J = 56.6, 4.5 Hz), 4.18 (2H, td, J = 12.8, 4.5 Hz).
419	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.66 (1H, s), 7.53-7.44 (1H, m), 7.01-6.95 (2H, m), 6.72 (1H, s), 6.16 (1H, tt, J = 56.4, 4.5 Hz), 4.20 (2H, td, J = 12.6, 4.5 Hz).
420	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.71 (1H, s), 7.47-7.37 (1H, m), 7.15 (1H, d, J = 5.5 Hz), 6.95-6.90 (2H, m), 6.87 (1H, d, J = 5.5 Hz), 6.18 (1H, tt, J = 56.4, 4.5 Hz), 4.22 (2H, td, J = 13.1, 4.5 Hz).

[表6-24]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
421	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.52-7.40 (2H, m), 7.00-6.95 (2H, m), 6.75 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.71 (1H, s), 6.14 (1H, tt, J = 56.6, 4.4 Hz), 4.16 (2H, td, J = 12.8, 4.4 Hz).
422	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.86 (1H, s), 7.52-7.44 (1H, m), 7.01-6.94 (2H, m), 6.84 (1H, s), 6.16 (1H, tt, J = 56.4, 4.5 Hz), 4.20 (2H, td, J = 12.7, 4.5 Hz).
423	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.91 (1H, s), 7.46-7.39 (1H, m), 7.15 (1H, d, J = 5.5 Hz), 6.95-6.90 (2H, m), 6.86 (1H, d, J = 5.5 Hz), 6.18 (1H, tt, J = 56.6, 4.5 Hz), 4.22 (2H, td, J = 12.7, 4.5 Hz).
424	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.39-7.31 (2H, m), 6.91-6.85 (2H, m), 6.82 (1H, d, J = 5.1 Hz), 6.74 (1H, d, J = 9.3 Hz), 6.53 (1H, d, J = 5.1 Hz), 6.17 (1H, tt, J = 56.8, 4.5 Hz), 4.17 (2H, td, J = 12.9, 4.5 Hz), 2.24 (3H, s).
425	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.54 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.33 (1H, dd, J = 3.9, 0.7 Hz), 7.25-7.20 (2H, m), 7.07 (1H, dd, J = 4.6, 0.7 Hz), 7.05-6.99 (1H, m), 6.75 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.34-6.04 (1H, m), 4.62-4.50 (1H, m), 3.61-3.50 (1H, m).
426	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.79 (1H, s), 7.35 (1H, dd, J = 4.0, 0.6 Hz), 7.26-7.19 (2H, m), 7.05-7.03 (2H, m), 6.36-6.06 (1H, m), 4.66-4.54 (1H, m), 3.67-3.57 (1H, m).
427	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.89 (1H, s), 7.39 (1H, d, J = 0.5 Hz), 7.18 (1H, d, J = 0.5 Hz), 7.11 (1H, d, J = 8.5 Hz), 6.99 (1H, d, J = 2.4 Hz), 6.80 (1H, dd, J = 8.5, 2.4 Hz), 4.31-4.23 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.57-3.50 (1H, m), 1.13 (3H, t, J = 7.1 Hz).
428	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.43 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.38 (1H, d, J = 0.5 Hz), 7.19 (1H, d, J = 0.5 Hz), 7.12 (1H, d, J = 8.5 Hz), 6.98 (1H, d, J = 2.4 Hz), 6.79 (1H, dd, J = 8.5, 2.4 Hz), 6.69 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.27-4.18 (1H, m), 3.83 (3H, s), 3.51-3.41 (1H, m), 1.11 (3H, t, J = 7.1 Hz).
429	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.61 (1H, s), 7.42-7.33 (1H, m), 7.03 (1H, d, J = 5.6 Hz), 6.91 (2H, t, J = 7.9 Hz), 6.53 (1H, d, J = 5.6 Hz), 3.45 (3H, s).
430	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.81 (1H, s), 7.41-7.33 (1H, m), 7.03 (1H, d, J = 5.6 Hz), 6.91 (2H, dd, J = 8.4, 7.4 Hz), 6.53 (1H, d, J = 5.6 Hz), 3.45 (3H, s).
431	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.35-7.29 (2H, m), 6.88 (2H, dd, J = 8.3, 7.3 Hz), 6.82 (1H, d, J = 5.2 Hz), 6.73 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.53 (1H, d, J = 5.2 Hz), 3.38 (3H, s), 2.23 (3H, s).
432	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.87 (1H, s), 7.48 (1H, tt, J = 8.5, 6.3 Hz), 7.00-6.95 (2H, m), 6.79 (1H, s), 6.16 (1H, tt, J = 56.5, 4.5 Hz), 4.21 (2H, td, J = 12.7, 4.5 Hz).
433	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.92 (1H, s), 7.43 (1H, tt, J = 8.5, 6.3 Hz), 7.15 (1H, d, J = 5.4 Hz), 6.96-6.90 (2H, m), 6.80 (1H, d, J = 5.4 Hz), 6.17 (1H, tt, J = 56.5, 4.5 Hz), 4.23 (2H, td, J = 12.7, 4.5 Hz).
434	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.52-7.42 (1H, m), 7.44 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.99-6.95 (2H, m), 6.78 (1H, s), 6.75 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.14 (1H, tt, J = 56.6, 4.5 Hz), 4.16 (2H, td, J = 12.9, 4.5 Hz).
435	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.44 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.38 (1H, tt, J = 8.6, 6.4 Hz), 7.11 (1H, d, J = 5.5 Hz), 6.94-6.90 (2H, m), 6.79 (1H, d, J = 5.5 Hz), 6.75 (1H, d, J = 9.5 Hz), 3.39 (3H, s).
436	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.67 (1H, s), 7.48 (1H, tt, J = 8.6, 6.4 Hz), 7.00-6.97 (2H, m), 6.67 (1H, s), 6.16 (1H, tt, J = 56.4, 4.5 Hz), 4.21 (2H, td, J = 12.6, 4.5 Hz).
437	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.71 (1H, s), 7.43 (1H, tt, J = 8.5, 6.3 Hz), 7.15 (1H, d, J = 5.4 Hz), 6.95-6.91 (2H, m), 6.80 (1H, d, J = 5.4 Hz), 6.17 (1H, tt, J = 56.5, 4.5 Hz), 4.23 (2H, td, J = 12.7, 4.5 Hz).

[表6-25]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
438	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.52-7.43 (1H, m), 7.44 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.00-6.95 (2H, m), 6.75 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.66 (1H, s), 6.14 (1H, tt, J = 56.5, 4.5 Hz), 4.16 (2H, td, J = 12.8, 4.5 Hz).
439	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.67 (1H, s), 7.40 (1H, tt, J = 8.5, 6.3 Hz), 7.14 (1H, d, J = 5.4 Hz), 6.96-6.90 (2H, m), 6.80 (1H, d, J = 5.4 Hz), 3.46 (3H, s).
440	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.62 (1H, s), 7.46 (1H, tt, J = 8.5, 6.3 Hz), 7.01-6.95 (2H, m), 6.66 (1H, s), 3.44 (3H, s).
441	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.87 (1H, s), 7.40 (1H, tt, J = 8.6, 6.4 Hz), 7.14 (1H, d, J = 5.2 Hz), 6.95-6.90 (2H, m), 6.80 (1H, d, J = 5.2 Hz), 3.46 (3H, s).
442	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.82 (1H, s), 7.45 (1H, tt, J = 8.6, 6.4 Hz), 6.99-6.95 (2H, m), 6.78 (1H, s), 3.44 (3H, s).
443	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.46-7.39 (1H, m), 7.37 (1H, d, J = 9.4 Hz), 6.96-6.92 (2H, m), 6.72 (1H, d, J = 9.4 Hz), 6.67 (1H, s), 6.15 (1H, tt, J = 56.5, 4.5 Hz), 4.15 (2H, td, J = 12.9, 4.5 Hz), 1.98 (3H, s).
444	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.72 (1H, s), 7.36-7.29 (1H, m), 6.87 (2H, dd, J = 8.5, 7.3 Hz), 6.80 (1H, d, J = 5.1 Hz), 6.53 (1H, d, J = 5.1 Hz), 3.94 (2H, q, J = 7.1 Hz), 2.25 (3H, s), 1.16 (3H, t, J = 7.1 Hz).
445	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.65 (1H, s), 7.42-7.35 (1H, m), 7.05 (1H, d, J = 5.1 Hz), 6.90 (2H, dd, J = 8.5, 7.3 Hz), 6.70 (1H, d, J = 5.1 Hz), 6.19 (1H, tt, J = 56.5, 4.5 Hz), 4.21 (2H, td, J = 12.8, 4.5 Hz), 2.05 (3H, s).
446	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.85 (1H, s), 7.42-7.35 (1H, m), 7.05 (1H, d, J = 5.1 Hz), 6.92-6.88 (2H, m), 6.70 (1H, d, J = 5.1 Hz), 6.19 (1H, tt, J = 56.5, 4.5 Hz), 4.21 (2H, td, J = 12.6, 4.5 Hz), 2.05 (3H, s).
447	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.54 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.40 (1H, dd, J = 7.6, 2.4 Hz), 7.33 (1H, d, J = 4.0 Hz), 7.25-7.22 (1H, m), 7.10-7.05 (2H, m), 6.75 (1H, d, J = 9.8 Hz), 6.32-6.08 (1H, m), 4.64-4.53 (1H, m), 3.58-3.49 (1H, m).
448	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.79 (1H, s), 7.42 (1H, dd, J = 7.8, 2.6 Hz), 7.35 (1H, dd, J = 4.0, 0.6 Hz), 7.25-7.22 (1H, m), 7.11-7.06 (2H, m), 6.34-6.09 (1H, m), 4.68-4.57 (1H, m), 3.64-3.56 (1H, m).
449	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.99 (1H, s), 7.41 (1H, dd, J = 8.0, 2.4 Hz), 7.35 (1H, dd, J = 4.0, 0.6 Hz), 7.25-7.22 (1H, m), 7.11-7.06 (2H, m), 6.33-6.10 (1H, m), 4.66-4.57 (1H, m), 3.65-3.56 (1H, m).
450	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.01 (1H, s), 7.36 (1H, dd, J = 4.0, 0.6 Hz), 7.17 (1H, d, J = 2.4 Hz), 7.10 (1H, dd, J = 8.6, 2.1 Hz), 7.05 (1H, dd, J = 4.9, 0.6 Hz), 6.86 (1H, dd, J = 8.6, 2.1 Hz), 6.34-6.09 (1H, m), 4.63-4.54 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.74-3.65 (1H, m).
451	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.46 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.39 (1H, d, J = 0.5 Hz), 7.25 (1H, dd, J = 8.5, 2.6 Hz), 7.19 (1H, d, J = 0.5 Hz), 7.16 (1H, dd, J = 8.5, 5.6 Hz), 7.04-6.98 (1H, m), 6.73 (1H, d, J = 9.5 Hz), 3.29 (3H, s).
452	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.72 (1H, s), 7.40 (1H, d, J = 0.6 Hz), 7.26 (1H, dd, J = 8.3, 2.4 Hz), 7.19-7.16 (2H, m), 7.05-7.00 (1H, m), 3.37 (3H, s).
453	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.91 (1H, s), 7.40 (1H, d, J = 0.7 Hz), 7.25-7.24 (1H, m), 7.18-7.16 (2H, m), 7.05-6.99 (1H, m), 3.37 (3H, s).
454	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.26 (1H, tt, J = 8.4, 6.4 Hz), 6.98 (1H, d, J = 5.6 Hz), 6.83-6.81 (2H, m), 6.49 (1H, d, J = 5.6 Hz), 2.89 (3H, s), 2.76-2.74 (4H, m).
455	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.80 (1H, s), 7.27 (1H, tt, J = 8.4, 6.4 Hz), 6.87 (1H, d, J = 5.6 Hz), 6.85-6.83 (2H, m), 6.55 (1H, d, J = 5.6 Hz), 2.92 (6H, s).
456	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.37-7.35 (2H, m), 7.01 (1H, d, J = 5.6 Hz), 6.91-6.89 (2H, m), 6.75 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.52 (1H, d, J = 5.6 Hz), 3.39 (3H, s).

[表6-26]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
457	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.25 (1H, tt, J = 8.4, 6.4 Hz), 6.96 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.83-6.81 (2H, m), 6.65 (1H, d, J = 4.9 Hz), 2.89 (3H, s), 2.77-2.69 (4H, m), 2.04 (3H, s).
458	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.35 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.22 (1H, dd, J = 8.6, 5.8 Hz), 7.15 (1H, dd, J = 8.3, 2.4 Hz), 6.98 (1H, ddd, J = 8.6, 8.0, 2.4 Hz), 6.84 (1H, d, J = 5.8 Hz), 6.71 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.47 (1H, d, J = 5.8 Hz), 4.23-4.18 (1H, m), 3.51-3.49 (1H, m), 1.13 (3H, t, J = 7.0 Hz).
459	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.78 (1H, s), 7.21 (1H, dd, J = 8.6, 5.8 Hz), 7.15 (1H, dd, J = 8.3, 2.8 Hz), 6.99 (1H, ddd, J = 8.6, 8.0, 2.8 Hz), 6.86 (1H, d, J = 5.5 Hz), 6.48 (1H, d, J = 5.5 Hz), 4.24 (1H, dq, J = 13.8, 7.0 Hz), 3.56 (1H, dq, J = 13.8, 7.0 Hz), 1.15 (3H, t, J = 7.0 Hz).
460	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.58 (1H, s), 7.21 (1H, dd, J = 8.5, 5.6 Hz), 7.16 (1H, dd, J = 8.3, 2.4 Hz), 6.99 (1H, ddd, J = 8.5, 8.3, 2.4 Hz), 6.86 (1H, d, J = 5.9 Hz), 6.48 (1H, d, J = 5.9 Hz), 4.25 (1H, dq, J = 13.7, 7.0 Hz), 3.56 (1H, dq, J = 13.7, 7.0 Hz), 1.15 (3H, t, J = 7.1 Hz).
461	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.73 (1H, s), 7.52-7.43 (1H, m), 7.32 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.16 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.02-6.97 (2H, m), 3.45 (3H, s).
462	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.93 (1H, s), 7.47-7.45 (1H, m), 7.32 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.16 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.00-6.98 (2H, m), 3.45 (3H, s).
463	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.46 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.33 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.11-7.09 (1H, m), 7.05 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.95-6.93 (1H, m), 6.91-6.87 (1H, m), 6.73 (1H, d, J = 9.8 Hz), 3.34 (3H, s).
464	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.71 (1H, s), 7.35 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.11-7.09 (1H, m), 7.04 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.98-6.88 (2H, m), 3.41 (3H, s).
465	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.91 (1H, s), 7.34 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.11-7.09 (1H, m), 7.04 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.96-6.94 (1H, m), 6.91-6.89 (1H, m), 3.41 (3H, s).
466	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.70 (1H, s), 7.30 (1H, s), 6.91-6.89 (1H, br m), 6.19-6.18 (1H, br m), 6.17-6.15 (1H, br m), 4.23-4.21 (1H, br m), 3.81-3.79 (1H, br m), 3.26-3.25 (4H, m), 2.03-2.00 (4H, m), 1.90 (3H, s), 1.15 (3H, t, J = 7.0 Hz).
467	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8.00 (1H, s), 7.48-7.42 (1H, m), 7.37 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.13 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.99-6.95 (2H, m), 5.15 (2H, br s).
468	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.98 (1H, s), 7.47-7.40 (1H, m), 7.37 (1H, d, J = 4.6 Hz), 7.13 (1H, d, J = 4.6 Hz), 6.96-6.95 (2H, m), 5.88 (1H, q, J = 5.9 Hz), 2.55 (3H, d, J = 5.9 Hz).
469	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.71 (1H, s), 7.28 (1H, s), 6.94-6.92 (1H, m), 6.55-6.52 (1H, br m), 6.51-6.50 (1H, m), 4.20-4.17 (1H, br m), 3.81-3.79 (1H, br m), 3.22-3.20 (4H, m), 1.89 (3H, s), 1.66-1.63 (6H, m), 1.15 (3H, t, J = 7.0 Hz).
470	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.75 (1H, s), 7.30 (1H, s), 7.02-6.97 (1H, m), 6.83-6.81 (1H, m), 6.74-6.72 (1H, m), 3.08 (3H, s), 2.71 (3H, s), 1.88 (3H, s).
471	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.87 (1H, s), 7.70-7.68 (1H, m), 7.65-7.63 (1H, m), 7.55-7.51 (1H, m), 7.48-7.47 (1H, m), 7.16 (1H, s), 7.12 (1H, s), 4.05-3.98 (1H, m), 3.74-3.71 (1H, m), 1.92 (3H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz).
472	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.77 (1H, s), 7.71-7.69 (1H, m), 7.61-7.59 (1H, m), 7.53-7.51 (1H, m), 7.46-7.44 (1H, m), 7.20 (1H, s), 4.17-4.12 (1H, m), 3.70-3.67 (1H, m), 1.86 (3H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.0 Hz).
473	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.84 (1H, s), 7.40-7.38 (1H, m), 7.30 (1H, s), 6.92-6.90 (2H, m), 5.19 (2H, br s), 1.93 (3H, s).
474	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.48 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.26 (1H, s), 7.23-7.21 (1H, m), 7.17-7.15 (1H, m), 6.98-6.96 (1H, m), 6.92 (1H, s), 6.71 (1H, d, J = 9.8 Hz), 3.29 (3H, s), 1.92 (3H, s).

[表6-27]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
475	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.81 (1H, s), 7.37-7.35 (1H, m), 7.29 (1H, s), 6.90-6.88 (2H, m), 5.92 (1H, q, J = 5.9 Hz), 2.55 (3H, d, J = 5.9 Hz), 1.92 (3H, s).
476	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.56 (1H, s), 7.25-7.17 (3H, m), 6.98-6.95 (1H, m), 3.40 (3H, s), 1.90 (3H, s).
477	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.80 (1H, s), 7.29 (1H, s), 7.20-7.15 (2H, m), 6.93-6.91 (1H, m), 5.27 (2H, br s), 1.91 (3H, s).
478	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.78 (1H, s), 7.30 (1H, s), 7.24-7.23 (1H, m), 7.15-7.13 (1H, m), 6.92-6.90 (1H, m), 5.97 (1H, q, J = 5.8 Hz), 2.47 (3H, d, J = 5.9 Hz), 1.91 (3H, s).
479	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.73 (1H, s), 7.24 (1H, s), 7.19-7.17 (1H, m), 7.11-7.08 (1H, m), 6.92-6.90 (1H, m), 3.08 (3H, s), 2.75 (3H, s), 1.90 (3H, s).
480	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.60 (1H, s), 7.41-7.32 (1H, m), 6.89 (2H, dd, J = 8.4, 7.4 Hz), 6.84 (1H, d, J = 5.1 Hz), 6.54 (1H, d, J = 5.1 Hz), 6.19 (1H, tt, J = 56.5, 4.5 Hz), 4.21 (2H, td, J = 12.8, 4.5 Hz), 2.25 (3H, s).
481	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.48 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.32 (1H, dd, J = 3.9, 0.7 Hz), 7.25 (1H, dd, J = 8.3, 2.4 Hz), 7.17 (1H, dd, J = 8.7, 5.7 Hz), 7.09 (1H, dd, J = 4.9, 0.7 Hz), 7.04-6.98 (1H, m), 6.73 (1H, d, J = 9.8 Hz), 3.30 (3H, s).
482	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.73 (1H, s), 7.34 (1H, dd, J = 3.9, 0.6 Hz), 7.26 (1H, dd, J = 7.8, 2.7 Hz), 7.16 (1H, dd, J = 8.7, 5.7 Hz), 7.08 (1H, dd, J = 4.8, 0.6 Hz), 7.04-7.00 (1H, m), 3.37 (3H, s).
483	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.93 (1H, s), 7.34 (1H, dd, J = 4.0, 0.7 Hz), 7.26 (1H, dd, J = 8.4, 2.4 Hz), 7.17 (1H, dd, J = 8.7, 5.7 Hz), 7.08 (1H, dd, J = 4.7, 0.7 Hz), 7.05-6.99 (1H, m), 3.37 (3H, s).
484	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.54 (1H, s), 7.38-7.30 (1H, m), 6.88 (2H, dd, J = 8.6, 7.3 Hz), 6.83 (1H, d, J = 5.2 Hz), 6.53 (1H, d, J = 5.2 Hz), 3.45 (3H, s), 2.24 (3H, s).
485	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.41 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.33-7.32 (1H, m), 7.28-7.26 (1H, m), 7.24 (1H, s), 7.06-7.05 (1H, m), 6.94 (1H, s), 6.69 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.03-4.00 (1H, m), 3.69-3.67 (1H, m), 1.94 (3H, s), 1.13 (3H, t, J = 7.0 Hz).
486	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.77 (1H, s), 7.47-7.44 (1H, m), 7.41-7.39 (1H, m), 7.32-7.30 (1H, m), 7.23 (1H, s), 4.16-4.13 (1H, m), 3.70-3.67 (1H, m), 1.89 (3H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.1 Hz).
487	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.49 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.44-7.38 (1H, m), 7.26 (1H, s), 7.17-7.05 (3H, m), 6.85 (1H, s), 6.71 (1H, d, J = 9.8 Hz), 3.35 (3H, s), 1.89 (3H, s).
488	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.59 (1H, s), 7.42-7.39 (1H, m), 7.28 (1H, s), 7.17-7.05 (3H, m), 3.45 (3H, d, J = 1.0 Hz), 1.86 (3H, s).
489	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.95 (1H, s), 7.46-7.40 (1H, m), 7.27 (1H, s), 7.18-7.05 (3H, m), 6.84 (1H, s), 3.42 (3H, d, J = 1.0 Hz), 1.89 (3H, s).
490	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.79 (1H, s), 7.41-7.39 (1H, m), 7.28 (1H, s), 7.13-7.07 (3H, m), 3.45 (3H, d, J = 1.2 Hz), 1.86 (3H, s).
491	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.42-7.33 (1H, m), 7.27-7.24 (1H, m), 6.93 (2H, dd, J = 8.3, 7.3 Hz), 6.72 (1H, d, J = 9.3 Hz), 6.50 (1H, s), 3.37 (3H, s), 2.15 (3H, s).
492	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.75 (1H, s), 7.37-7.31 (2H, m), 6.88 (2H, dd, J = 8.6, 7.3 Hz), 6.83 (1H, d, J = 5.2 Hz), 6.53 (1H, d, J = 5.2 Hz), 3.45 (3H, s).
493	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.51 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.41 (1H, tt, J = 8.4, 3.5 Hz), 7.15-7.12 (1H, m), 6.95-6.90 (3H, m), 6.74 (2H, dt, J = 10.3, 3.5 Hz), 6.16 (1H, tt, J = 56.6, 4.6 Hz), 4.16 (2H, td, J = 12.9, 4.6 Hz).

[表6-28]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
494	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.76 (1H, s), 7.45-7.39 (1H, m), 6.96-6.92 (2H, m), 6.51 (1H, s), 6.18 (1H, tt, J = 56.6, 4.5 Hz), 4.20 (2H, td, J = 12.7, 4.5 Hz), 2.17 (3H, s).
495	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.95 (1H, s), 7.48-7.40 (1H, m), 6.95 (2H, t, J = 8.3 Hz), 6.52 (1H, s), 6.18 (1H, tt, J = 56.5, 4.5 Hz), 4.43 (2H, s), 4.19 (2H, td, J = 12.3, 4.5 Hz).
496	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.37-7.33 (2H, m), 7.02 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.90-6.88 (2H, m), 6.72 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.70 (1H, d, J = 4.9 Hz), 3.38 (3H, s), 2.02 (3H, s).
497	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.35 (1H, d, J = 9.3 Hz), 7.10 (1H, d, J = 8.7 Hz), 6.91 (1H, d, J = 2.7 Hz), 6.82 (1H, d, J = 5.9 Hz), 6.76 (1H, dd, J = 8.7, 2.7 Hz), 6.68 (1H, d, J = 9.3 Hz), 6.47 (1H, d, J = 5.9 Hz), 4.21 (1H, dq, J = 13.2, 7.1 Hz), 3.81 (3H, s), 3.54 (1H, dq, J = 13.2, 7.1 Hz), 1.12 (3H, t, J = 7.1 Hz).
498	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.59 (1H, s), 7.41-7.32 (1H, m), 7.04 (1H, d, J = 5.1 Hz), 6.92-6.89 (2H, m), 6.70 (1H, d, J = 5.1 Hz), 3.45 (3H, s), 2.03 (3H, s).
499	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.76 (1H, s), 7.16-7.10 (1H, m), 7.04 (1H, d, J = 5.6 Hz), 6.88-6.81 (2H, m), 6.49 (1H, dd, J = 5.6, 0.7 Hz), 4.08-4.01 (1H, m), 3.84-3.81 (1H, m), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
500	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.32 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.15-7.12 (1H, m), 7.02 (1H, d, J = 5.6 Hz), 6.86-6.82 (2H, m), 6.70 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.48 (1H, d, J = 5.6 Hz), 4.04-3.97 (1H, m), 3.78-3.75 (1H, m), 1.14 (3H, t, J = 7.1 Hz).
501	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.55 (1H, s), 7.15-7.11 (1H, m), 7.04 (1H, d, J = 5.6 Hz), 6.88-6.81 (2H, m), 6.49 (1H, d, J = 5.6 Hz), 4.00-3.88 (2H, m), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
502	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.58 (1H, s), 7.09 (1H, d, J = 8.6 Hz), 6.91 (1H, d, J = 2.4 Hz), 6.83 (1H, d, J = 5.5 Hz), 6.76 (1H, dd, J = 8.6, 2.4 Hz), 6.48 (1H, d, J = 5.5 Hz), 4.25 (1H, dq, J = 13.1, 7.0 Hz), 3.81 (3H, s), 3.60 (1H, dq, J = 13.1, 7.0 Hz), 1.14 (3H, t, J = 7.0 Hz).
503	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.28-7.26 (1H, m), 7.10-7.04 (1H, m), 6.86-6.78 (3H, m), 6.68 (1H, d, J = 9.5 Hz), 6.47 (1H, d, J = 5.4 Hz), 4.04-4.00 (1H, m), 3.79-3.75 (1H, m), 2.22 (3H, s), 1.14 (3H, t, J = 7.1 Hz).
504	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.78 (1H, s), 7.09 (1H, d, J = 8.6 Hz), 6.91 (1H, d, J = 2.8 Hz), 6.83 (1H, d, J = 5.8 Hz), 6.76 (1H, dd, J = 8.6, 2.4 Hz), 6.48 (1H, d, J = 5.8 Hz), 4.26-4.23 (1H, m), 3.81 (3H, s), 3.62-3.59 (1H, m), 1.14 (3H, t, J = 7.0 Hz).
505	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.42 (1H, d, J = 9.5 Hz), 7.24 (1H, s), 7.17-7.15 (1H, m), 6.93 (1H, s), 6.89-6.86 (2H, m), 6.69 (1H, d, J = 9.5 Hz), 4.04-4.02 (1H, m), 3.71-3.68 (1H, m), 1.93 (3H, s), 1.13 (3H, t, J = 7.0 Hz).
506	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.30 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.24 (1H, s), 7.19-7.18 (1H, m), 6.86-6.83 (2H, m), 6.70 (1H, d, J = 9.8 Hz), 4.12-4.11 (1H, m), 3.70-3.67 (1H, m), 1.89 (3H, s), 1.14 (3H, t, J = 7.0 Hz).
507	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.57 (1H, s), 7.43 (1H, s), 7.42-7.41 (1H, m), 7.35-7.34 (1H, m), 7.24 (1H, s), 4.15-4.12 (1H, m), 3.72-3.69 (1H, m), 1.87 (3H, s), 1.17 (3H, t, J = 7.0 Hz).
508	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.67 (1H, s), 7.51-7.46 (2H, m), 7.35 (1H, dd, J = 7.9, 6.7 Hz), 7.29 (1H, d, J = 4.2 Hz), 7.15 (1H, d, J = 4.9 Hz), 4.04 (1H, dq, J = 13.8, 7.1 Hz), 3.74 (1H, dq, J = 13.8, 7.1 Hz), 1.17 (3H, t, J = 7.1 Hz).
509	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.75 (1H, s), 7.43 (1H, td, J = 8.3, 5.9 Hz), 7.34-7.32 (1H, m), 7.31-7.28 (1H, m), 7.17 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.11 (1H, td, J = 8.4, 0.9 Hz), 3.41 (3H, s).

[表6-29]

表 6 の続き

化合物	¹ H-NMR
510	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.94 (1H, s), 7.43 (1H, td, J = 8.3, 6.1 Hz), 7.34-7.31 (1H, m), 7.30-7.27 (1H, m), 7.17 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.11 (1H, td, J = 8.3, 1.0 Hz), 3.41 (3H, s).
511	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.52 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.25 (1H, s), 7.10-7.08 (1H, m), 6.96-6.89 (2H, m), 6.75 (1H, s), 6.69 (1H, d, J = 9.8 Hz), 3.24 (3H, s), 2.13 (3H, s), 1.91 (3H, s).
512	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.56 (1H, s), 7.22 (1H, s), 7.11-7.09 (1H, br m), 6.93-6.91 (1H, m), 6.86-6.84 (1H, m), 3.31 (3H, s), 2.21 (3H, s), 1.89 (3H, s).
513	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.98 (1H, s), 7.26 (1H, s), 7.10-7.07 (1H, m), 6.95-6.92 (2H, m), 6.73 (1H, s), 3.31 (3H, s), 2.12 (3H, s), 1.90 (3H, s).
514	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.75 (1H, s), 7.22 (1H, s), 7.11-7.09 (1H, m), 6.93-6.90 (1H, m), 6.86-6.84 (1H, m), 3.31 (3H, s), 2.21 (3H, s), 1.89 (3H, s).
515	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 7.76 (1H, s), 7.25 (1H, s), 7.23-7.21 (1H, br m), 7.19-7.17 (1H, m), 6.98-6.94 (1H, m), 3.40 (3H, s), 1.90 (3H, s).

[1341] 次に、本発明化合物が植物病害に有効であることを具体的に示すが、これらの例に限定されるものではない。

[1342] [試験例 A] イネいもち病

供試植物（イネ品種：幸風）の種子を播種後、第2葉が展開するまで栽培した。試験では、本発明化合物をジメチルスルホキシド・メタノール混合溶液（容積比：9／1）に溶解し、250ppmの濃度となるように井戸水で希釈して薬液を得た。得られた薬液を供試植物に散布した（2.5ml／ポット）。薬液が乾燥した後の植物に、 $1 \sim 2 \times 10^5$ 個／mlのイネいもち病菌（*Magnaporthe oryzae*）の分生孢子懸濁液を噴霧接種した。接種後、室温が20～23℃の湿室に約24時間放置し、発病を促した。接種6～10日後の発病程度を調査し、薬液の効果を評価した。

[1343] [試験例 B] トマト灰色かび病

供試植物（トマト品種：大型福寿）の種子を播種後、本葉が3～5枚展開するまで栽培した。試験では、本発明化合物をジメチルスルホキシド・メタノール混合溶液（容積比：9／1）に溶解し、250ppmの濃度となるように井戸水で希釈して薬液を得た。得られた薬液を供試植物に散布した（2.5ml／ポット）。薬液が乾燥した後の植物に、 $4 \sim 8 \times 10^5$ 個／mlの灰色かび病菌（*Botrytis cinerea*）の分生孢子懸濁液を噴霧接種した。接種後、室温が20～23℃の湿室に約48時間放置し、発病

を促した。接種2～3日後の発病程度を調査し、薬液の効果を評価した。

[1344] [試験例C] キャベツ黒すす病

供試植物（キャベツ品種：四季穫）の種子を播種後、子葉が展開するまで栽培した。試験では、本発明化合物をジメチルスルホキシド・メタノール混合溶液（容積比：9／1）に溶解し、250ppmの濃度となるように井戸水で希釈して薬液を得た。得られた薬液を供試植物に散布した（2.5ml／ポット）。薬液が乾燥した後の植物に、 $4\sim 8\times 10^5$ 個／mlのキャベツ黒すす病菌（*Alternaria brassicicola*）の分生孢子懸濁液を噴霧接種した。接種後、室温が20～23℃の湿室に約48時間放置し、発病を促した。接種2～3日後の発病程度を調査し、薬液の効果を評価した。

[1345] [試験例D] オオムギうどんこ病

供試植物（オオムギ品種：赤神力）の種子を播種後、第1葉が展開するまで栽培した。試験では、本発明化合物をジメチルスルホキシド・メタノール混合溶液（容積比：9／1）に溶解し、250ppmの濃度となるように井戸水で希釈して薬液を得た。得られた薬液を供試植物に散布した（2.5ml／ポット）。薬液が乾燥した後の植物に、オオムギうどんこ病菌（*Blumeria graminis* f. sp. *hordei*）の分生孢子を叩き落して接種した。接種後、6～10日後の発病程度を調査し、その効果を評価した。

[1346] [試験例E] コムギ赤さび病

供試植物（コムギ品種：農林61号）の種子を播種後、第1葉が展開するまで栽培した。試験では、本発明化合物をジメチルスルホキシド・メタノール混合溶液（容積比：9／1）に溶解し、250ppmの濃度となるように井戸水で希釈して薬液を得た。得られた薬液を供試植物に散布した（2.5ml／ポット）。薬液が乾燥した後の植物に、 $1\sim 2\times 10^5$ 個／mlのコムギ赤さび病菌（*Puccinia recondita*）の夏孢子懸濁液を噴霧接種した。接種後、室温が20～23℃の湿室に約24時間放置し、発

病を促した。接種7～10日後の発病程度を調査し、薬液の効果を評価した。

[1347] [試験例F] トマト疫病

供試植物（トマト品種：大型福寿）の種子を播種後、本葉が3～5枚展開するまで栽培した。試験では、本発明化合物をジメチルスルホキシドメタノール混合溶液（容積比：9／1）に溶解し、250ppmの濃度となるように井戸水で希釈して薬液を得た。得られた薬液を供試植物に散布した（2.5ml／ポット）。薬液が乾燥した後の植物に、 $4\sim 8\times 10^3$ 個／mlのトマト疫病菌（*Phytophthora infestans*）の遊走子の懸濁液を噴霧接種した。接種後、室温が20℃の湿室に約24時間放置し、発病を促した。接種5～10日後の発病程度を調査し、薬液の効果を評価した。

[1348] [試験例G] ブドウべと病

供試植物（ブドウ品種：ネオマスカット）の種子を播種後、本葉が3～4枚展開するまで栽培した。試験では、本発明化合物をジメチルスルホキシドメタノール混合溶液（容積比：9／1）に溶解し、250ppmの濃度となるように井戸水で希釈して薬液を得た。得られた薬液を供試植物に散布した（2.5ml／ポット）。薬液が乾燥した後の植物に、 $1\sim 2\times 10^4$ 個／mlのブドウべと病菌（*Plasmopara viticola*）の遊走子の懸濁液を噴霧接種した。接種後、室温が20℃の湿室に約24時間放置し、発病を促した。接種7～10日後の発病程度を調査し、薬液の効果を評価した。

[1349] [試験例H] キュウリ炭疽病

供試植物（キュウリ品種：相模半白）の種子を播種後、本葉が1枚展開するまで栽培した。試験では、本発明化合物をジメチルスルホキシドメタノール混合溶液（容積比：9／1）に溶解し、250ppmの濃度となるように井戸水で希釈して薬液を得た。得られた薬液を供試植物に散布した（2.5ml／ポット）。薬液が乾燥した後の植物に、 $2\sim 4\times 10^5$ 個／mlのキ

ユウリ炭疽病菌 (*Colletotrichum orbiculare*) の分生孢子懸濁液を噴霧接種した。接種後、室温が 20～23℃の湿室に約 24 時間放置し、発病を促した。接種 6～10 日後の発病程度を調査し、薬液の効果を評価した。

[1350] 以上の試験例の発病程度について、無発病の植物の発病程度を 0、薬剤無処理区の植物の発病程度を 3 として、0.05 ごとの発病程度の評価を行った。また、発病程度から以下の計算式に従って防除価を算出した。

[1351] <防除価>

$$\text{防除価} = 100 \{1 - (n/3)\}$$

n = 各薬剤処理区の発病程度

[1352] 以上の試験結果をまとめたものを表 7 に示す。表中、H は防除価が 50% より大きいもの表し、L は防除価が 50% 以下を表す。また、n t は試験を実施しなかったことを表す。

[1353]

[表7-1]

表 7

化合物	試験A	試験B	試験C	試験D	試験E	試験F	試験G	試験H
1	H	L	L	L	L	L	L	H
2	H	L	L	H	H	L	H	H
3	H	L	L	L	H	L	H	L
4	H	L	L	H	H	L	H	H
5	H	H	H	H	H	H	H	H
6	H	H	H	L	H	L	L	L
7	H	H	H	L	H	L	L	L
8	H	H	H	L	L	L	H	L
9	H	H	H	H	L	L	L	H
10	H	H	H	L	L	L	L	H
11	H	L	H	H	H	L	L	L
12	H	H	H	L	H	L	L	H
13	H	H	H	L	H	L	L	H
14	L	H	L	H	H	L	H	L
15	L	H	L	H	H	L	L	H
16	L	H	H	H	H	L	L	H
17	nt	H	nt	H	H	nt	nt	nt
18	H	H	H	H	H	L	L	H
19	H	H	H	H	H	L	L	H
20	H	H	H	H	H	L	L	H
21	H	H	H	H	H	L	H	H
22	H	H	H	H	H	L	H	H
23	H	H	H	H	H	L	L	H
24	H	H	H	H	H	L	H	H
25	L	L	H	H	L	L	L	H
26	H	H	H	H	H	L	L	H
27	L	H	H	H	H	L	L	H
28	H	H	H	H	H	L	L	H
29	H	H	H	H	H	L	L	H
30	L	L	L	H	L	L	L	L
31	L	H	H	H	L	L	L	H
32	L	H	H	L	H	L	L	L
33	H	L	H	L	L	L	L	L
34	H	H	H	H	H	L	L	H
35	H	H	H	H	H	L	L	H
36	H	L	H	L	H	L	L	H
37	H	H	H	L	H	L	L	H
38	H	L	L	L	L	L	L	L
39	H	H	H	L	H	L	L	H
40	H	H	H	H	H	L	L	H
41	H	H	H	H	H	L	L	H
42	L	H	H	L	H	L	L	H

[表7-2]

表 7 の続き

化合物	試験A	試験B	試験C	試験D	試験E	試験F	試験G	試験H
43	H	H	H	H	H	L	L	H
44	H	H	H	H	H	L	H	H
45	H	H	H	H	H	L	L	L
46	H	H	H	H	H	L	H	H
47	L	H	H	H	H	L	L	H
48	H	H	H	H	H	L	H	H
49	H	H	H	H	H	L	H	H
50	H	H	H	H	H	L	H	H
51	H	H	H	H	H	L	H	H
52	H	H	H	H	H	L	L	H
53	H	H	H	L	H	L	L	H
54	H	H	H	H	H	L	L	L
55	H	H	H	H	H	L	L	H
56	H	H	H	H	H	L	H	H
57	H	H	H	H	H	L	L	H
58	H	H	L	H	H	L	L	H
59	H	H	H	H	H	L	L	H
60	L	H	L	H	L	L	L	L
61	H	H	H	H	H	L	H	H
62	H	H	H	H	H	L	H	H
63	H	H	H	H	H	L	H	H
64	H	H	L	H	H	L	L	L
65	H	H	H	H	H	L	H	H
66	H	nt	H	nt	nt	L	H	H
67	H	H	H	H	H	L	H	H
68	H	H	H	H	H	L	L	H
69	H	H	H	H	H	L	L	H
70	H	H	H	H	H	L	L	L
71	H	H	H	H	H	L	L	H
72	H	H	H	H	H	L	L	H
73	H	H	H	H	H	L	L	H
74	H	H	H	H	H	L	H	H
75	H	H	H	L	L	L	L	L
76	H	H	H	H	L	L	L	L
77	H	H	H	H	H	L	L	H
78	H	H	H	H	H	L	L	H
79	H	H	H	H	H	L	L	H
80	H	H	H	H	H	L	L	H
81	H	H	H	H	H	L	L	H
82	H	H	H	H	H	L	H	H
83	H	H	H	H	H	L	L	H
84	H	H	H	H	H	L	L	H

[表7-3]

表 7 の続き

化合物	試験A	試験B	試験C	試験D	試験E	試験F	試験G	試験H
85	H	H	H	H	H	L	L	H
86	H	H	H	H	H	L	L	H
87	L	L	H	L	L	L	L	L
88	L	L	H	L	L	L	L	L
89	H	H	H	L	H	L	L	H
90	L	H	H	L	H	L	L	H
91	L	L	H	L	L	L	L	L
92	L	H	L	L	L	L	L	L
93	L	H	H	H	L	L	L	H
94	H	H	H	H	H	L	L	H
95	H	H	H	H	L	L	L	H
96	H	L	L	L	L	L	L	L
97	H	H	H	H	H	L	H	H
98	H	H	H	H	H	L	L	H
99	H	H	H	H	H	L	H	H
100	H	H	H	H	H	L	L	H
101	H	H	H	H	H	L	L	H
102	H	H	H	L	L	L	H	H
103	H	H	H	H	H	L	L	H
104	H	H	H	H	H	L	L	H
105	L	H	H	L	H	nt	L	H
106	H	H	H	L	H	H	H	H
107	H	H	H	H	H	L	H	H
108	H	H	H	H	H	L	L	H
109	H	H	H	H	H	L	L	H
110	H	H	H	H	H	L	L	L
111	H	H	H	H	H	L	L	H
112	H	H	H	H	H	L	H	H
113	H	H	H	H	H	L	L	H
114	H	H	H	L	H	L	L	H
115	H	H	H	L	H	L	H	H
116	H	H	H	L	H	H	H	H
117	L	L	H	L	L	L	L	L
118	H	H	H	H	H	L	H	H
119	L	L	H	L	L	L	L	L
120	H	H	H	L	H	L	L	H
121	H	L	L	L	L	L	L	L
122	H	H	H	H	H	L	L	L
123	L	H	H	L	L	L	L	L
124	H	H	H	L	L	L	L	H
125	H	H	H	L	H	L	L	H
126	H	H	H	L	H	L	L	H

[表7-4]

表 7 の続き

化合物	試験A	試験B	試験C	試験D	試験E	試験F	試験G	試験H
127	H	H	H	H	H	L	L	H
128	L	L	H	H	H	L	H	L
129	H	L	H	L	L	L	H	L
130	L	L	H	L	L	L	L	L
131	L	L	H	L	L	L	L	L
132	H	H	H	H	H	L	H	H
133	H	H	H	H	H	L	H	H
134	L	H	L	L	L	L	L	L
135	L	L	L	L	L	L	H	L
136	H	H	H	H	H	L	H	H
137	H	H	H	H	H	L	H	H
138	H	H	H	H	H	L	L	H
139	H	H	H	H	H	L	H	H
140	L	H	H	H	H	L	L	H
141	H	H	H	H	H	L	L	H
142	H	L	H	L	L	L	L	H
143	L	H	H	L	H	L	L	H
144	H	L	H	L	L	L	L	L
145	H	H	H	H	H	L	L	H
146	H	H	H	L	H	L	H	H
147	H	L	H	L	L	L	L	L
148	H	H	H	H	H	L	L	H
149	H	H	H	H	H	L	L	H
150	H	H	H	H	H	L	L	H
151	H	H	H	L	H	L	L	L
152	H	H	H	L	H	L	L	H
153	H	H	H	H	H	L	H	H
154	H	L	L	L	L	L	L	L
155	L	L	H	L	L	L	L	H
156	H	H	H	H	H	L	L	H
157	H	H	H	H	H	L	L	H
158	H	H	H	H	H	L	L	H
159	H	H	H	H	H	L	L	H
160	L	H	H	L	L	L	L	L
161	H	H	H	L	H	L	L	L
162	L	L	L	L	L	L	H	L
163	L	L	L	L	L	L	H	L
164	H	H	H	H	H	L	L	H
165	H	H	H	H	H	L	L	H
166	H	H	H	L	H	L	H	H
167	H	H	H	L	H	L	H	H
168	H	L	H	H	H	L	L	H

[表7-5]

表 7 の続き

化合物	試験A	試験B	試験C	試験D	試験E	試験F	試験G	試験H
169	L	H	H	H	H	L	L	H
170	H	L	H	L	L	L	L	H
171	H	L	L	L	L	L	L	L
172	H	H	H	L	H	L	L	H
173	H	H	H	H	H	L	L	H
174	H	H	H	H	H	H	L	H
175	H	H	H	H	H	H	L	H
176	H	H	H	H	H	L	L	H
177	H	H	H	H	H	L	H	H
178	H	H	H	H	H	L	H	H
179	H	H	H	H	H	L	H	H
180	H	H	H	H	H	L	L	H
181	H	H	H	H	H	H	H	H
182	H	H	H	H	H	H	H	H
183	L	H	H	H	H	L	H	H
184	L	H	H	L	H	L	H	H
185	L	H	L	H	H	L	L	L
186	H	H	H	H	H	L	L	H
187	H	H	H	H	H	L	L	H
188	H	H	H	H	H	L	L	H
189	H	H	H	H	H	L	L	H
190	H	H	H	H	H	L	L	H
191	H	H	H	H	H	L	L	H
192	H	H	H	H	H	L	H	H
193	H	H	H	H	H	L	H	H
194	H	H	H	H	H	L	L	H
195	H	H	H	L	H	L	L	H
196	H	H	H	L	H	L	L	L
197	H	H	H	H	H	L	L	H
198	L	L	H	L	L	L	L	L
199	L	L	H	L	L	L	L	L
200	H	H	H	H	H	L	L	H
201	H	H	H	H	H	L	L	H
202	H	H	H	H	H	L	L	H
203	H	H	H	H	H	L	L	H
204	L	H	H	L	L	L	L	H
205	L	H	H	L	H	L	L	L
206	H	H	H	H	H	L	L	H
207	H	H	H	H	H	L	H	H
208	H	H	H	H	H	L	L	H
209	H	H	H	H	H	L	L	H
210	L	H	L	L	H	L	L	H

[表7-6]

表 7 の続き

化合物	試験A	試験B	試験C	試験D	試験E	試験F	試験G	試験H
211	H	L	H	H	H	L	L	L
212	H	L	H	H	L	L	L	L
213	H	H	H	H	H	L	L	H
214	H	L	H	H	H	L	H	L
215	H	H	H	H	H	H	H	H
216	L	H	H	H	H	L	L	H
217	L	H	H	H	H	L	L	L
218	H	L	H	L	L	L	L	L
219	L	L	L	L	L	L	H	L
220	H	H	H	H	H	L	L	H
221	L	L	H	L	L	L	L	L
222	H	H	H	H	H	L	L	H
223	H	L	H	L	L	L	H	L
224	L	H	H	H	H	L	H	H
225	L	L	H	H	H	L	H	L
226	H	H	H	H	H	L	H	H
227	L	H	H	H	H	L	L	L
228	H	H	H	H	H	L	L	H
229	H	H	H	H	H	L	L	H
230	H	H	H	H	H	L	H	H
231	H	H	H	H	H	L	L	L
232	H	H	H	H	H	L	L	L
233	H	H	H	H	H	L	L	L
234	L	H	H	H	H	L	L	L
235	H	H	H	H	H	L	L	L
236	H	H	H	H	H	L	H	H
237	L	L	H	L	L	L	L	L
238	H	H	H	H	H	L	L	H
239	H	H	H	H	H	L	L	H
240	L	H	H	H	H	L	L	H
241	L	H	L	L	H	L	L	L
242	L	H	L	L	L	L	L	L
243	L	H	H	L	H	L	L	L
244	H	H	H	H	H	L	L	H
245	H	H	H	H	H	L	L	H
246	L	L	L	L	L	L	L	H
247	L	H	L	L	L	L	L	L
248	H	H	H	H	H	L	L	H
249	L	H	H	H	H	L	L	L
250	H	H	H	H	H	L	L	H
251	H	H	H	H	H	L	L	H
252	H	H	H	H	H	L	L	H

[表7-7]

表 7 の続き

化合物	試験A	試験B	試験C	試験D	試験E	試験F	試験G	試験H
253	L	H	H	L	H	L	L	L
254	H	H	H	H	H	L	H	H
255	H	H	H	H	H	L	H	H
256	H	H	H	H	H	L	L	H
257	L	H	L	L	L	L	L	H
258	L	L	L	L	H	L	L	L
259	L	L	H	H	H	L	L	L
260	L	L	H	L	L	L	L	L
261	H	H	H	H	H	L	L	H
262	H	H	H	H	H	L	L	H
263	H	H	H	H	H	L	L	H
264	H	H	H	L	H	L	L	H
265	L	L	H	H	H	L	L	L
266	H	H	H	H	H	L	H	H
267	H	H	H	H	H	L	L	H
268	L	L	H	H	H	L	L	L
269	H	H	H	H	H	L	L	L
270	H	H	H	H	H	L	L	H
271	H	H	H	H	H	L	H	H
272	H	H	H	H	H	L	L	H
273	H	H	H	H	H	L	L	L
274	H	H	H	H	H	L	L	L
275	H	H	H	H	H	L	L	L
276	L	L	H	H	L	L	L	L
277	H	H	H	H	H	L	H	L
278	H	H	H	H	H	L	H	L
279	H	H	H	L	H	L	L	H
280	H	L	H	L	H	L	L	H
281	L	L	H	H	L	L	L	L
282	H	H	H	H	H	L	L	H
283	H	H	H	H	H	L	L	H
284	H	H	H	H	H	L	L	H
285	H	H	H	H	H	L	L	H
286	H	H	H	H	H	L	L	H
287	H	H	H	L	H	L	L	H
288	H	H	H	L	H	L	L	H
289	L	L	H	H	H	L	L	L
290	L	L	H	H	H	H	L	L
291	L	L	H	L	L	L	L	L
292	L	H	H	H	H	L	L	L
293	H	H	H	H	H	L	L	L
294	H	L	H	H	H	L	L	L

[表7-8]

表 7 の続き

化合物	試験A	試験B	試験C	試験D	試験E	試験F	試験G	試験H
295	L	H	H	H	H	L	H	L
296	H	H	H	H	H	L	H	H
297	L	L	L	L	H	L	L	L
298	H	H	H	L	H	L	L	H
299	H	H	H	L	H	L	L	H
300	H	H	H	H	H	L	L	H
301	H	H	H	H	H	L	L	H
302	H	H	H	H	H	L	H	H
303	L	L	H	H	H	L	L	L
304	L	L	H	H	L	L	L	L
305	L	L	H	H	H	L	L	L
306	H	H	H	H	H	L	L	H
307	H	H	H	H	H	L	L	H
308	H	H	H	H	H	L	L	H
309	H	H	H	H	H	L	L	L
310	H	H	H	H	H	L	L	H
311	H	H	H	H	H	L	L	H
312	H	H	H	H	H	L	L	H
313	H	H	H	H	H	L	L	H
314	H	H	H	H	H	L	L	H
315	H	H	H	H	H	L	L	H
316	H	H	H	H	H	L	L	H
317	L	H	H	L	H	L	L	H
318	L	H	H	H	H	H	L	H
319	H	H	H	H	H	L	L	H
320	H	H	H	H	H	L	L	H
321	L	L	L	L	L	L	L	H
322	L	H	H	H	H	L	L	L
323	H	H	H	H	H	H	H	H
324	L	L	L	L	L	L	H	H
325	L	L	H	L	L	L	L	L
326	H	H	H	H	H	L	L	H
327	H	H	H	H	H	L	L	H
328	H	H	H	H	H	L	L	H
329	H	H	H	L	L	L	L	H
330	H	H	H	H	H	L	L	H
331	H	H	H	H	H	L	H	H
332	H	H	H	H	H	L	H	H
333	H	H	H	H	H	L	H	H
334	H	H	H	H	H	L	L	H
335	H	H	H	H	H	L	H	H
336	H	H	H	H	H	H	H	H

[表7-9]

表 7 の続き

化合物	試験A	試験B	試験C	試験D	試験E	試験F	試験G	試験H
337	H	H	H	H	H	H	H	H
338	H	H	H	H	H	L	L	H
339	H	H	H	H	H	L	L	H
340	H	H	H	H	H	L	H	H
341	H	H	H	H	H	H	L	H
342	H	H	H	H	H	L	L	H
343	H	H	H	H	H	L	H	H
344	H	H	H	H	H	L	H	H
345	H	H	H	H	H	L	H	H
346	H	H	H	H	H	L	H	H
347	H	H	H	H	H	L	H	H
348	H	H	H	L	H	L	L	L
349	H	H	H	L	H	L	H	H
350	L	H	H	H	H	L	H	H
351	H	H	H	H	H	L	L	H
352	H	H	H	H	H	L	L	H
353	H	H	H	H	H	L	L	H
354	H	H	H	H	H	L	H	H
355	H	H	H	L	H	L	L	H
356	L	H	H	H	H	L	L	L
357	H	H	H	H	H	L	L	H
358	H	H	H	L	H	L	L	H
359	H	H	H	H	H	H	H	H
360	H	H	H	H	H	L	L	H
361	H	H	H	H	H	L	L	H
362	H	H	H	H	H	L	H	H
363	H	H	H	L	H	L	L	H
364	H	H	H	H	H	L	H	H
365	H	H	H	H	H	L	H	H
366	H	H	H	H	H	L	H	H
367	L	L	H	H	L	L	L	L
368	L	nt	H	nt	nt	L	H	L
369	H	H	H	H	H	L	L	H
370	H	H	H	H	H	L	L	L
371	H	H	H	H	H	L	H	H
372	L	L	L	H	L	L	H	L
373	H	H	H	L	H	L	H	H
374	L	L	L	H	H	L	H	H
375	H	H	H	H	H	L	H	H
376	L	H	L	L	H	L	H	H
377	H	H	H	H	H	H	L	H
378	H	H	H	H	H	H	L	H

[表7-10]

表 7 の続き

化合物	試験A	試験B	試験C	試験D	試験E	試験F	試験G	試験H
379	H	H	H	L	H	L	L	H
380	H	H	H	L	H	L	L	H
381	H	H	H	H	H	H	H	H
382	H	H	L	H	H	L	L	H
383	H	H	H	H	H	L	L	H
384	H	H	H	H	H	L	L	H
385	H	H	H	H	H	H	H	H
386	H	H	H	H	H	L	L	L
387	H	H	H	H	H	L	L	L
388	H	H	H	H	H	L	L	L
389	H	H	H	H	H	L	L	H
390	H	H	H	L	H	L	L	L
391	H	H	L	L	H	H	L	L
392	H	H	H	L	L	H	L	L
393	H	H	H	L	H	H	H	H
394	H	H	H	H	H	H	H	H
395	H	H	H	H	H	L	L	H
396	H	L	L	L	L	L	L	L
397	H	H	H	H	H	L	L	H
398	H	H	H	L	H	L	L	H
399	L	H	L	L	H	L	L	L
400	H	L	H	L	L	L	L	L
401	L	L	H	L	L	L	L	L
402	H	L	H	L	L	L	L	L
403	H	H	H	L	L	L	L	L
404	H	L	H	L	L	L	L	L
405	L	L	H	H	H	L	L	L
406	L	L	H	H	L	L	L	L
407	H	H	H	H	H	L	L	H
408	H	H	H	L	H	L	L	L
409	H	H	H	H	H	L	L	L
410	H	H	H	H	H	L	H	H
411	H	H	H	L	H	L	L	L
412	H	H	H	H	H	L	H	H
413	L	H	L	H	L	L	L	H
414	H	H	H	H	H	L	L	H
415	L	nt	L	nt	nt	H	L	H
416	H	H	H	H	H	L	H	H
417	H	nt	H	nt	nt	H	L	L
418	H	H	H	H	H	L	L	H
419	H	nt	H	nt	nt	L	L	H
420	H	nt	H	nt	nt	H	L	H

[表7-11]

表 7 の続き

化合物	試験A	試験B	試験C	試験D	試験E	試験F	試験G	試験H
421	H	H	H	H	H	L	L	H
422	H	L	H	H	H	L	L	L
423	H	H	H	H	H	L	H	H
424	H	H	H	H	H	H	H	H
425	H	H	H	H	H	L	L	H
426	H	H	H	H	H	L	L	H
427	H	H	H	L	H	L	L	H
428	H	L	H	H	H	L	L	H
429	H	H	H	L	H	L	L	H
430	H	H	H	L	H	L	L	H
431	H	H	H	L	H	L	L	H
432	H	H	H	H	L	L	L	H
433	H	H	H	H	H	L	L	H
434	H	L	L	L	L	L	L	L
435	H	H	H	L	H	L	H	H
436	H	H	H	H	H	L	H	H
437	H	H	H	H	H	L	L	H
438	H	L	H	H	H	L	L	H
439	H	H	H	H	H	L	H	H
440	H	L	H	L	L	L	H	L
441	H	H	H	L	H	L	L	H
442	H	L	L	L	L	L	L	L
443	H	H	H	H	H	L	L	H
444	H	L	H	L	H	L	L	L
445	H	H	H	H	H	L	L	H
446	H	H	H	H	H	L	L	H
447	H	H	H	H	H	L	L	L
448	H	H	H	H	H	L	L	L
449	H	H	H	H	H	L	L	H
450	H	H	H	L	H	L	L	H
451	L	L	H	H	H	L	H	L
452	H	H	H	H	H	L	L	H
453	H	H	H	L	H	L	L	H
454	L	H	H	H	H	L	H	H
455	L	L	H	L	L	L	L	L
456	H	H	H	L	H	L	L	H
457	L	H	H	L	H	L	L	H
458	H	H	H	H	H	L	L	H
459	H	H	H	L	H	L	L	H
460	H	H	H	H	H	L	H	H
461	H	H	H	H	H	L	L	H
462	H	H	H	H	H	L	L	H

[表7-12]

表 7 の続き

化合物	試験A	試験B	試験C	試験D	試験E	試験F	試験G	試験H
463	L	L	H	H	L	L	L	H
464	H	H	H	L	H	L	L	H
465	H	H	H	L	H	L	L	H
466	H	H	H	L	H	L	L	L
467	L	H	L	L	L	L	L	L
468	H	H	H	L	H	L	L	H
469	H	H	H	H	H	L	L	H
470	L	H	H	H	H	L	H	H
471	L	L	H	L	L	L	L	L
472	H	H	H	L	H	L	H	H
473	L	H	H	L	H	L	H	L
474	L	H	L	H	H	L	L	L
475	H	H	H	H	H	L	H	H
476	H	H	H	H	H	L	H	H
477	H	H	H	L	H	L	L	L
478	H	H	H	H	H	L	L	H
479	L	H	H	H	H	L	H	H
480	L	L	H	L	L	L	L	L
481	L	H	L	H	H	L	L	L
482	H	H	H	H	H	L	L	H
483	L	H	H	H	H	L	L	H
484	H	H	H	L	H	L	L	L
485	L	L	H	H	H	L	L	L
486	H	H	H	H	H	L	H	H
487	L	L	L	L	L	L	H	L
488	H	H	H	H	H	L	H	H
489	L	L	H	L	H	L	L	L
490	H	H	H	H	H	L	H	H
491	L	H	L	L	H	L	H	L
492	L	H	H	L	H	L	L	L
493	H	H	H	H	H	L	H	L
494	H	L	H	H	H	L	H	H
495	H	H	H	L	H	L	H	L
496	H	H	H	L	H	L	H	L
497	H	H	H	L	H	L	H	H
498	H	H	H	H	H	L	H	H
499	H	H	H	L	H	L	H	H
500	H	H	H	L	H	L	H	L
501	H	H	H	L	H	L	H	H
502	H	H	H	L	H	L	H	H
503	H	H	H	H	H	L	H	H
504	H	H	H	L	H	L	H	H

[表7-13]

表 7 の続き

化合物	試験A	試験B	試験C	試験D	試験E	試験F	試験G	試験H
505	H	H	H	H	H	L	H	L
506	H	H	H	H	H	L	H	H
507	H	nt	H	nt	nt	L	H	H
508	L	L	H	L	H	L	L	H
509	L	H	H	H	H	L	H	H
510	L	H	H	H	H	L	L	H
511	L	L	L	H	L	L	L	L
512	H	H	H	H	H	L	L	H
513	L	L	H	L	H	L	L	L
514	H	H	H	H	H	L	L	H
515	H	H	H	H	H	L	H	H

産業上の利用可能性

[1366] 本発明のピリドン化合物は新規な化合物であり、植物病害を防除することができるので、農薬、例えば、農園芸用有害生物防除剤、特に農園芸用殺菌剤としての利用価値がある。

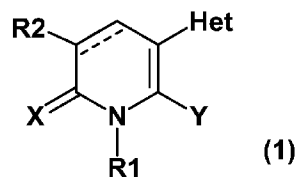
[1367] 日本国特許出願 2017-78492 号（出願日：2017 年 4 月 11 日）、および日本国特許出願 2017-199795 号（出願日：2017 年 10 月 13 日）の開示はその全体が参照により本明細書に取り込まれる。

[1368] 本明細書に記載された全ての文献、特許出願、および技術規格は、個々の文献、特許出願、および技術規格が参照により取り込まれることが具体的かつ個々に記された場合と同程度に、本明細書に参照により取り込まれる。

請求の範囲

[請求項1] 式(1)

[化275]



[式中、R 1 は、

水酸基、

シアノ基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、

C 1～C 6のハロアルキル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルキル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニル基、

C 2～C 6のハロアルケニル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、

C 2～C 6のハロアルキニル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、

C 1～C 6のハロアルコキシ基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルコキシ基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニルオキシ基、

C 2～C 6のハロアルケニルオキシ基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 3～C 6のアルキニルオキシ基、

C 3～C 6のハロアルキニルオキシ基、

またはR a R b N－（ここで、R a およびR b は、それぞれ独立して、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、またはC 3～C 8のシクロアルキル基を表すか、あるいはR a およびR b は、結合する窒素原子と

一緒になって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、
ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、またはアゾカニル基を形成するものを表す。)を表し;

R²は、

水素原子、

ニトロ基、

ハロゲン原子、

置換基Aで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基、

C¹～C⁶のハロアルキル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC³～C⁸のシクロアルキル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC²～C⁶のアルケニル基、

C²～C⁶のハロアルケニル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC²～C⁶のアルキニル基、

C²～C⁶のハロアルキニル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルコキシ基、

C¹～C⁶のハロアルコキシ基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC³～C⁸のシクロアルコキシ基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC²～C⁶のアルケニルオキシ基、

C²～C⁶のハロアルケニルオキシ基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC³～C⁶のアルキニルオキシ基、

C³～C⁶のハロアルキニルオキシ基、

R^c—L—(ここで、R^cは、C¹～C⁶のアルキル基、またはC¹～C⁶のハロアルキル基を表し、Lは、S、SO、またはSO₂を表す。)、

またはR^{x1}C(=O)—(ここで、R^{x1}は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基、C¹～C⁶のハロアルキル基、C³～C⁸のシクロアルキル基、C¹～C⁶のアルコキシ基、C¹～C⁶のハロアルコキシ基、C³～C⁸のシクロアルコキシ基、

シ基、または $R^a R^b N-$ （ここで、 R^a および R^b は前記と同義である。）を表す。）を表し；

H e t は、

5～6員の複素環基、または8～10員の複素環基を表し、

該5～6員の複素環基、または該8～10員の複素環基は、 R^3 が適宜0～6置換し（ただし、2置換以上の R^3 がある場合、 R^3 はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

R^3 は、

水酸基、

シアノ基、

ニトロ基、

ハロゲン原子、

置換基Cで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、

C1～C6のハロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC3～C8のシクロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC2～C6のアルケニル基、

C2～C6ハロアルケニル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC2～C6のアルキニル基、

C2～C6のハロアルキニル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC1～C6のアルコキシ基、

C1～C6のハロアルコキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC3～C8のシクロアルコキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC2～C6のアルケニルオキシ基、

C2～C6のハロアルケニルオキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC3～C6のアルキニルオキシ基、

C3～C6のハロアルキニルオキシ基、

置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基、

置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基、

置換基Dで適宜置換されてもよいアリールオキシ基、
 置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリールオキシ基、
 置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキルオキシ基、
 $R^a R^b N-$ （ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。）、
 R^c-L- （ここで、 R^c および L は、前記と同義である。）、
 $R^{x1}C(=O)-$ （ここで R^{x1} は、前記と同義である。）、
 $R^{x1}C(=O)O-$ （ここで R^{x1} は、前記と同義である。）、
 $R^{x2}C(=O)N(R^{x3})-$ （ここで、 R^{x2} は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよい $C1\sim C6$ のアルキル基、 $C1\sim C6$ のハロアルキル基、 $C3\sim C8$ のシクロアルキル基、 $C1\sim C6$ のアルコキシ基、 $C1\sim C6$ のハロアルコキシ基、 $C3\sim C8$ のシクロアルコキシ基、または $R^a R^b N-$ （ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。）を表し、 R^{x3} は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよい $C1\sim C6$ のアルキル基、 $C1\sim C6$ のハロアルキル基、または $C3\sim C8$ のシクロアルキル基を表す。）、
 $R^{x4}R^{x5}C=N-O-$ （ここで、 R^{x4} および R^{x5} は、それぞれ独立して、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよい $C1\sim C6$ のアルキル基、 $C1\sim C6$ のハロアルキル基、 $C3\sim C8$ のシクロアルキル基、 $C1\sim C6$ のアルコキシ基、 $C1\sim C6$ のハロアルコキシ基、 $C3\sim C8$ のシクロアルコキシ基、または $R^a R^b N-$ （ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。）を表す。）、
 または1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基を表し；
 Y は、
 フェニル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、テトラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、またはチアジアゾリル基を表し、
 該フェニル基は、 R^4 がオルト位に置換し、さらに R^5 が適宜0～4置換し（ただし、2置換以上の R^5 がある場合、 R^5 はそれぞれ独立

した置換基を表す。）、

該ピリジル基、該ピリダジニル基、該ピリミジニル基、該ピラジニル基、該トリアジニル基、または該テトラジニル基は、R 4 がオルト位に置換し、さらにR 5 が適宜0～3置換し（ただし、2置換以上のR 5 がある場合、R 5 はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

該チエニル基、該チアゾリル基、該イソチアゾリル基、または該チアジアゾリル基は、R 4 がオルト位に置換し、さらにR 5 が適宜0～2置換し（ただし、2置換のR 5 がある場合、R 5 はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

R 4 は、

水酸基、

シアノ基、

ニトロ基、

ハロゲン原子、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、

C 1～C 6のハロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニル基、

C 2～C 6ハロアルケニル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、

C 2～C 6のハロアルキニル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、

C 1～C 6のハロアルコキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルコキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニルオキシ基、

C 2～C 6のハロアルケニルオキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 6のアルキニルオキシ基、

C 3～C 6のハロアルキニルオキシ基、

置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基、
置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基、
置換基Dで適宜置換されてもよいアリールオキシ基、
置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリールオキシ基、
置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキルオキシ基、
 $R^a R^b N-$ （ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。）、
 R^c-L- （ここで、 R^c および L は、前記と同義である。）、
 $R^{x1}C(=O)-$ （ここで R^{x1} は、前記と同義である。）、
 $R^{x1}C(=O)O-$ （ここで R^{x1} は、前記と同義である。）、
 $R^{x2}C(=O)N(R^{x3})-$ （ここで、 R^{x2} は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよい $C1\sim C6$ のアルキル基、 $C1\sim C6$ のハロアルキル基、 $C3\sim C8$ のシクロアルキル基、 $C1\sim C6$ のアルコキシ基、 $C1\sim C6$ のハロアルコキシ基、 $C3\sim C8$ のシクロアルコキシ基、または $R^a R^b N-$ （ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。）を表し、 R^{x3} は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよい $C1\sim C6$ のアルキル基、 $C1\sim C6$ のハロアルキル基、または $C3\sim C8$ のシクロアルキル基を表す。）、
 $R^{x4}R^{x5}C=N-O-$ （ここで、 R^{x4} および R^{x5} は、それぞれ独立して、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよい $C1\sim C6$ のアルキル基、 $C1\sim C6$ のハロアルキル基、 $C3\sim C8$ のシクロアルキル基、 $C1\sim C6$ のアルコキシ基、 $C1\sim C6$ のハロアルコキシ基、 $C3\sim C8$ のシクロアルコキシ基、または $R^a R^b N-$ （ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。）を表す。）、
または1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基を表し、
 R^5 は、前記に記載の R^4 と同義であり；
 X は、酸素原子、または硫黄原子を表し；
破線部を含む結合は、二重結合、または単結合を表し；
そして、置換基Aは、水酸基、シアノ基、 $C3\sim C8$ のシクロアルキ

ル基、C 1～C 6のアルコキシ基、C 1～C 6のハロアルコキシ基、C 3～C 8のシクロアルコキシ基、R a R b N－（ここで、R aおよびR bは、前記と同義である。）、およびR c－L－（ここで、R cおよびLは、前記と同義である。）からなる群から選択される少なくとも1種であり；

置換基Bは、シアノ基、C 1～C 6のアルコキシ基、C 1～C 6のハロアルコキシ基、およびC 3～C 8のシクロアルコキシ基からなる群から選択される少なくとも1種であり；

置換基Cは、水酸基、シアノ基、C 3～C 8のシクロアルキル基、C 1～C 6のアルコキシ基、C 1～C 6のハロアルコキシ基、C 3～C 8のシクロアルコキシ基、C 2～C 6のアルコキシアルコキシ基、R a R b N－（ここで、R aおよびR bは、前記と同義である。）、R c－L－（ここでR cおよびLは、前記と同義である。）、R x 1 C（＝O）－（ここでR x 1は、前記と同義である。）、および1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基からなる群から選択される少なくとも1種であり；

置換基Dは、水酸基、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、置換基Bで置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、C 3～C 8のシクロアルキル基、C 1～C 6のアルコキシ基、C 1～C 6のハロアルコキシ基、およびC 3～C 8のシクロアルコキシ基からなる群から選択される少なくとも1種である。］で表される化合物またはその塩。

[請求項2]

H e tは、

ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、テトラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、チアトリアゾリル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ペンタゾリル基、フリル基、オキサゾリル基、インドリル基、イソイン

ドリル基、インダゾリル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフリル基、イソベンゾフリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチエニル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾイソチアゾリル基、ベンゾチアジアゾリル基、インドリジニル基、イミダゾピリジニル基、ピラゾロピリジニル基、トリアゾロピリジニル基、ピロロピリミジニル基、イミダゾピリミジニル基、ピラゾロピリミジニル基、トリアゾロピリミジニル基、ピロロピラジニル基、イミダゾピラジニル基、ピラゾロピラジニル基、トリアゾロピラジニル基、キノリル基、イソキノリル基、シノリル基、フタラジニル基、キノキサリニル基、キナゾリニル基、ナフチリジニル基、または1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基を表し、

該ピリジニル基、該ピリダジニル基、該ピリミジニル基、該ピラジニル基、該トリアジニル基、または該テトラジニル基は、R³が適宜0～4置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。））、

該チエニル基、該チアゾリル基、該イソチアゾリル基、該チアジアゾリル基、または該チアトリアゾリル基は、R³が適宜0～3置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。））、

該ピロリル基、該ピラゾリル基、該イミダゾリル基、該トリアゾリル基、該テトラゾリル基、または該ペンタゾリル基は、R³が適宜0～4置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。））、

該フリル基、または該オキサゾリル基は、R³が適宜0～3置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。））、

該インドリル基、該イソインドリル基、該インダゾリル基、該ベンゾイミダゾリル基、または該ベンゾトリアゾリル基は、R³が適宜0～

6置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

該ベンゾフリル基、該イソベンゾフリル基、または該ベンゾオキサゾリル基は、R³が適宜0～5置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

該ベンゾチエニル基、該ベンゾチアゾリル基、該ベンゾイソチアゾリル基、または該ベンゾチアジアゾリル基は、R³が適宜0～5置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

該インドリジニル基、該イミダゾピリジル基、該ピラゾロピリジル基、または該トリアゾロピリジル基は、R³が適宜0～6置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

該ピロロピリミジニル基、該イミダゾピリミジニル基、該ピラゾロピリミジニル基、該トリアゾロピリミジニル基、該ピロロピラジニル基、該イミダゾピラジニル基、該ピラゾロピラジニル基、または該トリアゾロピラジニル基は、R³が適宜0～5置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

該キノリル基、該イソキノリル基、該シノリル基、該フタラジニル基、該キノキサリニル基、該キナゾリニル基、または該ナフチリジニル基は、R³が適宜0～6置換する（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

請求項1に記載の化合物またはその塩。

[請求項3]

R¹は、

置換基Aで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基、

C¹～C⁶のハロアルキル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC²～C⁶のアルケニル基、

C²～C⁶のハロアルケニル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルキニル基、
C₂～C₆のハロアルキニル基、
またはR_aR_bN-（ここで、R_aおよびR_bは、それぞれ独立して
いて、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアル
キル基、C₁～C₆のハロアルキル基、またはC₃～C₈のシクロアル
キル基を表すか、あるいはR_aおよびR_bは、結合する窒素原子と
一緒になって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、
ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、またはアゾカニル基を形成す
るものを表す。）を表し；

R₂は、

水素原子、

ハロゲン原子、

置換基Aで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルキル基、

C₁～C₆のハロアルキル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルキニル基、

C₂～C₆のハロアルキニル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、

C₁～C₆のハロアルコキシ基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルケニルオキシ基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC₃～C₆のアルキニルオキシ基、

R_c-L-（ここで、R_cは、C₁～C₆のアルキル基、またはC₁
～C₆のハロアルキル基を表し、Lは、S、SO、またはSO₂を表
す。） 、

またはR_x1C(=O)-（ここで、R_x1は、水素原子、置換基B
で適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルキル基、C₁～C₆のハロ
アルキル基、C₃～C₈のシクロアルキル基、C₁～C₆のアルコキ
シ基、C₁～C₆のハロアルコキシ基、C₃～C₈のシクロアルコキ
シ基、またはR_aR_bN-（ここで、R_aおよびR_bは前記と同義で

ある。)を表す。)を表し；

H e t は、

ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、テトラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、チアトリアゾリル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ペンタゾリル基、フリル基、オキサゾリル基、または1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基を表し、

該ピリジル基、該ピリダジニル基、該ピリミジニル基、該ピラジニル基、該トリアジニル基、または該テトラジニル基は、R³が適宜0～4置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

該チエニル基、該チアゾリル基、該イソチアゾリル基、該チアジアゾリル基、または該チアトリアゾリル基は、R³が適宜0～3置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

該ピロリル基、該ピラゾリル基、該イミダゾリル基、該トリアゾリル基、該テトラゾリル基、または該ペンタゾリル基は、R³が適宜0～4置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

該フリル基、または該オキサゾリル基は、R³が適宜0～3置換し（ただし、2置換以上のR³がある場合、R³はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

R³は、

シアノ基、

ニトロ基、

ハロゲン原子、

置換基Cで適宜置換されてもよいC¹～C⁶のアルキル基、

C 1 ~ C 6 のハロアルキル基、
置換基 C で適宜置換されてもよい C 3 ~ C 8 のシクロアルキル基、
置換基 C で適宜置換されてもよい C 2 ~ C 6 のアルケニル基、
置換基 C で適宜置換されてもよい C 2 ~ C 6 のアルキニル基、
置換基 C で適宜置換されてもよい C 1 ~ C 6 のアルコキシ基、
C 1 ~ C 6 のハロアルコキシ基、
置換基 C で適宜置換されてもよい C 3 ~ C 8 のシクロアルコキシ基、
置換基 C で適宜置換されてもよい C 2 ~ C 6 のアルケニルオキシ基、
置換基 C で適宜置換されてもよい C 3 ~ C 6 のアルキニルオキシ基、
R a R b N - (ここで、R a および R b は、それぞれ独立して、
水素原子、置換基 B で適宜置換されてもよい C 1 ~ C 6 のアルキル基、
C 1 ~ C 6 のハロアルキル基、または C 3 ~ C 8 のシクロアルキル基を表すか、あるいは R a および R b は、結合する窒素原子と一緒に
なって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、またはアゾカニル基を形成するものを表す。)、
R c - L - (ここで、R c および L は、前記と同義である。)、
R x 1 C (=O) - (ここで R x 1 は、前記と同義である。)、
R x 1 C (=O) O - (ここで R x 1 は、前記と同義である。)、
R x 2 C (=O) N (R x 3) - (ここで、R x 2 は、水素原子、置換基 B で適宜置換されてもよい C 1 ~ C 6 のアルキル基、C 1 ~ C 6 のハロアルキル基、C 3 ~ C 8 のシクロアルキル基、C 1 ~ C 6 のアルコキシ基、C 1 ~ C 6 のハロアルコキシ基、C 3 ~ C 8 のシクロアルコキシ基、または R a R b N - (ここで、R a および R b は、前記と同義である。)を表し、R x 3 は、水素原子、置換基 B で適宜置換されてもよい C 1 ~ C 6 のアルキル基、C 1 ~ C 6 のハロアルキル基、または C 3 ~ C 8 のシクロアルキル基を表す。)を表し；
Y は、

フェニル基、またはピリジル基を表し、

該フェニル基は、R 4 がオルト位に置換し、さらにR 5 が適宜0～4置換し（ただし、2置換以上のR 5 がある場合、R 5 はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

該ピリジル基は、R 4 がオルト位に置換し、さらにR 5 が適宜0～3置換し（ただし、2置換以上のR 5 がある場合、R 5 はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

R 4 は、

シアノ基、

ニトロ基、

ハロゲン原子、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、

C 1～C 6のハロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、

またはC 1～C 6のハロアルコキシ基を表し、

R 5 は、

水酸基、

シアノ基、

ハロゲン原子、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、

C 1～C 6のハロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、

C 1～C 6のハロアルコキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルコキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニルオキシ基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC₃～C₆のアルキニルオキシ基、
R_aR_bN－（ここで、R_aおよびR_bは、前記と同義である。）、
R_c－L－（ここで、R_cおよびLは、前記と同義である。）、
またはR_x1C(=O)O－（ここでR_x1は、前記と同義である。
）を表す、

請求項2に記載の化合物またはその塩。

[請求項4]

R₁は、

置換基Aで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルキル基、
C₁～C₆のハロアルキル基、
またはR_aR_bN－（ここで、R_aおよびR_bは、それぞれ独立して
いて、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアル
キル基、C₁～C₆のハロアルキル基、またはC₃～C₈のシクロア
ルキル基を表すか、あるいはR_aおよびR_bは、結合する窒素原子と
一緒になって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、
ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、またはアゾカニル基を形成す
るものを表す。）を表し；

R₂は、

水素原子、

ハロゲン原子、

置換基Aで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルキル基、
C₁～C₆のハロアルキル基、
置換基Aで適宜置換されてもよいC₂～C₆のアルキニル基、
置換基Aで適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、
またはR_x1C(=O)－（ここで、R_x1は、水素原子、置換基B
で適宜置換されてもよいC₁～C₆のアルキル基、C₁～C₆のハロ
アルキル基、C₃～C₈のシクロアルキル基、C₁～C₆のアルコキ
シ基、C₁～C₆のハロアルコキシ基、C₃～C₈のシクロアルコキ
シ基、またはR_aR_bN－（ここで、R_aおよびR_bは前記と同義で

ある。)を表す。)を表し；

H e t は、

ピリジル基、チエニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、オキサゾリル基、または1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基を表し、

該ピリジル基は、R 3 が適宜0～4置換し（ただし、2置換以上のR 3 がある場合、R 3 はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

該チエニル基は、R 3 が適宜0～3置換し（ただし、2置換以上のR 3 がある場合、R 3 はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

該ピロリル基、該ピラゾリル基、該イミダゾリル基、該トリアゾリル基、または該テトラゾリル基は、R 3 がそれぞれ独立して適宜0～4置換し（ただし、2置換以上のR 3 がある場合、R 3 はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

該オキサゾリル基は、R 3 が適宜0～2置換し（ただし、2置換のR 3 がある場合、R 3 はそれぞれ独立した置換基を表す。）、

R 3 は、

シアノ基、

ニトロ基、

ハロゲン原子、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 1 ～C 6 のアルキル基、

C 1 ～C 6 のハロアルキル基、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 1 ～C 6 のアルコキシ基、

R a R b N－（ここで、R a およびR b は、それぞれ独立して、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC 1 ～C 6 のアルキル基、C 1 ～C 6 のハロアルキル基、またはC 3 ～C 8 のシクロアルキル基を表すか、あるいはR a およびR b は、結合する窒素原子と一緒に、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、またはアゾカニル基を形成するもの

を表す。)、

$R \times 1 C (=O) -$ (ここで $R \times 1$ は、前記と同義である。)、

$R \times 2 C (=O) N (R \times 3) -$ (ここで、 $R \times 2$ は、水素原子、置換基 B で適宜置換されてもよい C 1 ~ C 6 のアルキル基、C 1 ~ C 6 のハロアルキル基、C 3 ~ C 8 のシクロアルキル基、C 1 ~ C 6 のアルコキシ基、C 1 ~ C 6 のハロアルコキシ基、C 3 ~ C 8 のシクロアルコキシ基、または $R^a R^b N -$ (ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。) を表し、 $R \times 3$ は、水素原子、置換基 B で適宜置換されてもよい C 1 ~ C 6 のアルキル基、C 1 ~ C 6 のハロアルキル基、または C 3 ~ C 8 のシクロアルキル基を表す。)

を表し；

Y は、

フェニル基を表し、

該フェニル基は、 R^4 がオルト位に置換し、さらに R^5 が適宜 0 ~ 4 置換し (ただし、2 置換以上の R^5 がある場合、 R^5 はそれぞれ独立した置換基を表す。)、

R^4 は、

シアノ基、

ニトロ基、

ハロゲン原子、

置換基 C で適宜置換されてもよい C 1 ~ C 6 のアルキル基、

C 1 ~ C 6 のハロアルキル基、

または置換基 C で適宜置換されてもよい C 1 ~ C 6 のアルコキシ基を表し、

R^5 は、

水酸基、

シアノ基、

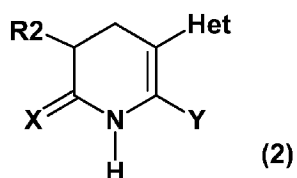
ハロゲン原子、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、
 置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、
 置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニルオキシ基、
 置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 6のアルキニルオキシ基、
 $R^a R^b N-$ （ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。）、
 R^c-L- （ここで、 R^c および L は、前記と同義である。）、
 または $R^{x1}C(=O)O-$ （ここで R^{x1} は、前記と同義である。）を表す、

請求項3に記載の化合物またはその塩。

[請求項5] 式(2)

[化276]



[式中、 R^2 は、

水素原子、

ニトロ基、

ハロゲン原子、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、

C 1～C 6のハロアルキル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルキル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニル基、

C 2～C 6のハロアルケニル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、

C 2～C 6のハロアルキニル基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、

C 1～C 6のハロアルコキシ基、

置換基Aで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルコキシ基、

置換基 A で適宜置換されてもよい C 2 ～ C 6 のアルケニルオキシ基、
C 2 ～ C 6 のハロアルケニルオキシ基、

置換基 A で適宜置換されてもよい C 3 ～ C 6 のアルキニルオキシ基、
C 3 ～ C 6 のハロアルキニルオキシ基、

$R_c - L -$ （ここで、 R_c は、C 1 ～ C 6 のアルキル基、または C 1
～ C 6 のハロアルキル基を表し、L は、S、SO、または SO_2 を表
す。） 、

または $R_{x1}C(=O) -$ （ここで、 R_{x1} は、水素原子、置換基 B
で適宜置換されてもよい C 1 ～ C 6 のアルキル基、C 1 ～ C 6 のハロ
アルキル基、C 3 ～ C 8 のシクロアルキル基、C 1 ～ C 6 のアルコキ
シ基、C 1 ～ C 6 のハロアルコキシ基、C 3 ～ C 8 のシクロアルコキ
シ基、または $R_a R_b N -$ （ここで、 R_a および R_b は、それぞれ独
立していて、水素原子、置換基 B で適宜置換されてもよい C 1 ～ C 6
のアルキル基、C 1 ～ C 6 のハロアルキル基、または C 3 ～ C 8 のシ
クロアルキル基を表すか、あるいは R_a および R_b は、結合する窒素
原子と一緒にあって、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニ
ル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、またはアゾカニル基を
形成するものを表す。）を表す。）を表し；

H e t は、

5 ～ 6 員の複素環基、または 8 ～ 10 員の複素環基を表し、
該 5 ～ 6 員の複素環基、または該 8 ～ 10 員の複素環基は、 R_3 が適
宜 0 ～ 6 置換し（ただし、2 置換以上の R_3 がある場合、 R_3 はそれ
ぞれ独立した置換基を表す。） 、

R_3 は、

水酸基、

シアノ基、

ニトロ基、

ハロゲン原子、

置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、
C 1～C 6のハロアルキル基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルキル基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニル基、
C 2～C 6ハロアルケニル基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、
C 2～C 6のハロアルキニル基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、
C 1～C 6のハロアルコキシ基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルコキシ基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニルオキシ基、
C 2～C 6のハロアルケニルオキシ基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 6のアルキニルオキシ基、
C 3～C 6のハロアルキニルオキシ基、
置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基、
置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基、
置換基Dで適宜置換されてもよいアリールオキシ基、
置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリールオキシ基、
置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキルオキシ基、
R a R b N－（ここで、R a およびR b は、前記と同義である。）、
R c－L－（ここで、R c およびL は、前記と同義である。）、
R x 1 C（＝O）－（ここでR x 1 は、前記と同義である。）、
R x 1 C（＝O）O－（ここでR x 1 は、前記と同義である。）、
R x 2 C（＝O）N（R x 3）－（ここで、R x 2 は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、C 3～C 8のシクロアルキル基、C 1～C 6のアルコキシ基、C 1～C 6のハロアルコキシ基、C 3～C 8のシクロアルコキシ基、またはR a R b N－（ここで、R a およびR b は、前記

と同義である。)を表し、 $R \times 3$ は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、またはC3～C8のシクロアルキル基を表す。)、

$R \times 4$ $R \times 5$ $C=N-O-$ (ここで、 $R \times 4$ および $R \times 5$ は、それぞれ独立していて、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC1～C6のアルキル基、C1～C6のハロアルキル基、C3～C8のシクロアルキル基、C1～C6のアルコキシ基、C1～C6のハロアルコキシ基、C3～C8のシクロアルコキシ基、または $R^a R^b N-$ (ここで、 R^a および R^b は、前記と同義である。)を表す。)、

または1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基を表し；

Yは、

フェニル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、テトラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、またはチアジアゾリル基を表し、

該フェニル基は、 R_4 がオルト位に置換し、さらに R_5 が適宜0～4置換し(ただし、2置換以上の R_5 がある場合、 R_5 はそれぞれ独立した置換基を表す。)、

該ピリジル基、該ピリダジニル基、該ピリミジニル基、該ピラジニル基、該トリアジニル基、または該テトラジニル基は、 R_4 がオルト位に置換し、さらに R_5 が適宜0～3置換し(ただし、2置換以上の R_5 がある場合、 R_5 はそれぞれ独立した置換基を表す。)、

該チエニル基、該チアゾリル基、該イソチアゾリル基、または該チアジアゾリル基は、 R_4 がオルト位に置換し、さらに R_5 が、適宜0～2置換し(ただし、2置換の R_5 がある場合、 R_5 はそれぞれ独立した置換基を表す。)、

R_4 は、

水酸基、

シアノ基、

ニトロ基、
ハロゲン原子、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、
C 1～C 6のハロアルキル基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルキル基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニル基、
C 2～C 6ハロアルケニル基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルキニル基、
C 2～C 6のハロアルキニル基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルコキシ基、
C 1～C 6のハロアルコキシ基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 8のシクロアルコキシ基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 2～C 6のアルケニルオキシ基、
C 2～C 6のハロアルケニルオキシ基、
置換基Cで適宜置換されてもよいC 3～C 6のアルキニルオキシ基、
C 3～C 6のハロアルキニルオキシ基、
置換基Dで適宜置換されてもよいアリール基、
置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリール基、
置換基Dで適宜置換されてもよいアリールオキシ基、
置換基Dで適宜置換されてもよいヘテロアリールオキシ基、
置換基Dで適宜置換されてもよいアラルキルオキシ基、
R a R b N－（ここで、R a およびR b は、前記と同義である。）、
R c－L－（ここで、R c およびL は、前記と同義である。）、
R x 1 C（=O）－（ここでR x 1 は、前記と同義である。）、
R x 1 C（=O）O－（ここでR x 1 は、前記と同義である。）、
R x 2 C（=O）N（R x 3）－（ここで、R x 2 は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、C 3～C 8のシクロアルキル基、C 1～C 6のア

ルコキシ基、C 1～C 6のハロアルコキシ基、C 3～C 8のシクロアルコキシ基、またはR a R b N－（ここで、R aおよびR bは、前記と同義である。）を表し、R x 3は、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、またはC 3～C 8のシクロアルキル基を表す。） 、

R x 4 R x 5 C=N－O－（ここで、R x 4およびR x 5は、それぞれ独立していて、水素原子、置換基Bで適宜置換されてもよいC 1～C 6のアルキル基、C 1～C 6のハロアルキル基、C 3～C 8のシクロアルキル基、C 1～C 6のアルコキシ基、C 1～C 6のハロアルコキシ基、C 3～C 8のシクロアルコキシ基、またはR a R b N－（ここで、R aおよびR bは、前記と同義である。）を表す。） 、

または1～2個の酸素原子を含む3～6員環の基を表し、

R 5は、前記に記載のR 4と同義であり；

Xは、酸素原子、または硫黄原子を表し；

そして、置換基Aは、水酸基、シアノ基、C 3～C 8のシクロアルキル基、C 1～C 6のアルコキシ基、C 1～C 6のハロアルコキシ基、C 3～C 8のシクロアルコキシ基、R a R b N－（ここで、R aおよびR bは、前記と同義である。） 、およびR c－L－（ここで、R cおよびLは、前記と同義である。） からなる群から選択される少なくとも1種であり；

置換基Bは、シアノ基、C 1～C 6のアルコキシ基、C 1～C 6のハロアルコキシ基、およびC 3～C 8のシクロアルコキシ基からなる群から選択される少なくとも1種であり；

置換基Cは、水酸基、シアノ基、C 3～C 8のシクロアルキル基、C 1～C 6のアルコキシ基、C 1～C 6のハロアルコキシ基、C 3～C 8のシクロアルコキシ基、C 2～C 6のアルコキシアルコキシ基、R a R b N－（ここで、R aおよびR bは、前記と同義である。） 、R c－L－（ここでR cおよびLは、前記と同義である。） 、R x 1 C

(=O) - (ここで $R \times 1$ は、前記と同義である。)、および 1 ~ 2 個の酸素原子を含む 3 ~ 6 員環の基からなる群から選択される少なくとも 1 種であり；

置換基 D は、水酸基、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、置換基 B で置換されてもよい C 1 ~ C 6 のアルキル基、C 1 ~ C 6 のハロアルキル基、C 3 ~ C 8 のシクロアルキル基、C 1 ~ C 6 のアルコキシ基、C 1 ~ C 6 のハロアルコキシ基、および C 3 ~ C 8 のシクロアルコキシ基からなる群から選択される少なくとも 1 種である。] で表される化合物またはその塩。

[請求項6] 請求項 1 に記載の化合物またはその塩を有効成分として含有する農園芸用有害生物防除剤。

[請求項7] 請求項 1 に記載の化合物またはその塩を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤。

[請求項8] 請求項 6 に記載の農園芸用有害生物防除剤を、植物、植物の種子、または植物を栽培する土壌に施用することを含む、植物病害を防除する方法。

[請求項9] 請求項 7 に記載の農園芸用殺菌剤を、植物、植物の種子、または植物を栽培する土壌に施用することを含む、植物病害を防除する方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2018/015142

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl. C07D213/64 (2006.01)i, A01N43/40 (2006.01)i, A01N43/56 (2006.01)i,
A01N43/653 (2006.01)i, A01P3/00 (2006.01)i, C07D401/04 (2006.01)i,
C07D405/04 (2006.01)i, C07D409/04 (2006.01)i, C07D413/04 (2006.01)i

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl. C07D213/64, A01N43/40, A01N43/56, A01N43/653, A01P3/00, C07D401/04,
C07D405/04, C07D409/04, C07D413/04

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Published examined utility model applications of Japan	1922-1996
Published unexamined utility model applications of Japan	1971-2018
Registered utility model specifications of Japan	1996-2018
Published registered utility model applications of Japan	1994-2018

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS/REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 1-128969 A (MERCK & CO., INC.) 22 May 1989, entire text & EP 308020 A2	1-9
A	JP 2014-525452 A (PTC THERAPEUTICS, INC.) 29 September 2014, entire text & US 2015/0080362 A1 & WO 2013/033240 A1 & EP 2750505 A1 & CN 103889223 A & KR 10-2014-0085437 A	1-9
A	JP 2005-530810 A (AMGEN INC.) 13 October 2005, entire text & US 2005/0038010 A1 & WO 2003/099808 A1 & EP 1506186 A1	1-9
A	WO 2001/000208 A1 (MERCK & CO., INC.) 04 January 2001, entire text & US 6403596 B1	1-9
E, A	WO 2017/061525 A1 (MITSUI CHEMICALS AGRO, INC.) 13 April 2017, entire text (Family: none)	1-9

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"I" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
01 June 2018 (01.06.2018)

Date of mailing of the international search report
12 June 2018 (12.06.2018)

Name and mailing address of the ISA/
Japan Patent Office
3-4-3, Kasumigaseki, Chiyoda-ku,
Tokyo 100-8915, Japan

Authorized officer

Telephone No.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. C07D213/64(2006.01)i, A01N43/40(2006.01)i, A01N43/56(2006.01)i, A01N43/653(2006.01)i, A01P3/00(2006.01)i, C07D401/04(2006.01)i, C07D405/04(2006.01)i, C07D409/04(2006.01)i, C07D413/04(2006.01)i

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. C07D213/64, A01N43/40, A01N43/56, A01N43/653, A01P3/00, C07D401/04, C07D405/04, C07D409/04, C07D413/04

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	1922-1996年
日本国公開実用新案公報	1971-2018年
日本国実用新案登録公報	1996-2018年
日本国登録実用新案公報	1994-2018年

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAplus/REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
A	JP 1-128969 A (メルク エンド カムパニー インコーポレーテツド) 1989.05.22, 全文 & EP 308020 A2	1-9
A	JP 2014-525452 A (ピーティージー セラピューティクス, インコーポレイテッド) 2014.09.29, 全文 & US 2015/0080362 A1 & WO 2013/033240 A1 & EP 2750505 A1 & CN 103889223 A & KR 10-2014-0085437 A	1-9

☑ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

01.06.2018

国際調査報告の発送日

12.06.2018

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

三上 晶子

4 P

4042

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
A	JP 2005-530810 A (アムジエン・インコーポレーテッド) 2005. 10. 13, 全文 & US 2005/0038010 A1 & WO 2003/099808 A1 & EP 1506186 A1	1-9
A	WO 2001/000208 A1 (MERCK & CO., INC.) 2001. 01. 04, 全文 & US 6403596 B1	1-9
E, A	WO 2017/061525 A1 (三井化学アグロ株式会社) 2017. 04. 13, 全文 (ファミリーなし)	1-9